

特開平10-316634

(43) 公開日 平成10年(1998)12月2日

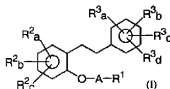
(51) Int.Cl. ⁵ C 0 7 C 217/18 A 6 1 K 31/135 31/40	識別記号 A B X A B Y A C B A E D	F I C 0 7 C 217/18 A 6 1 K 31/135 31/40 A B X A B Y A C B A E D
審査請求 未請求 請求項の数21 O L (全 79 頁) 最終頁に続く		
(21) 出願番号 特願平9-125202	(71) 出願人 000001856	三共株式会社 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 (72) 発明者 藤木 光一 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 (72) 発明者 田中 直樹 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 (72) 発明者 小川 武利 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 (74) 代理人 弁理士 大野 彰夫 (外2名) 最終頁に続く
(22) 出願日 平成9年(1997)5月15日		

(54) 【発明の名称】 フェノキシアルキルアミン類

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 すぐれたセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を持ち、動脈硬化性疾患等の治療剤又は予防剤として有用であるジアリールアルカン類又はその薬理上許容される塩を提供する。

【解決手段】 一般式 I

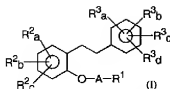


脂環式アミン類又はその薬理上許容される塩。一般式 I の化合物の具体例には 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジンがある。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式

【化1】



【式中、 R^1 は、アミノ基、モノー若しくはジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリ基（該置換基は、炭素原子上の置換基は、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_2 - C_7$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_6$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基は、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールで置換された $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_9$ アルコキシカルボニル基を示す。）を示し、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c は、同一又は異なって、水素原子、 $C_2 - C_{10}$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 $C_7 - C_{10}$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_{10}$ アルコキシ基、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル基、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシ基、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル基、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールオキシ基を示すか、或は R^2a 、 R^2b 及び R^2c から選択される2個の基がそれと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、

A は、単結合又は $C_1 - C_6$ アルキレン基を示す。但し、 R^1 がアミノ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_6$

アルキルアミノ基である場合は、 A は $C_2 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c の1個は、水素原子以外の基を示す。）を有する基を示す。）を有するフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項2】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基、ピペリジニル基若しくはモルホリニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{18}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項3】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_6 - C_{16}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_2 - C_6$ アルカノイルオキシ基、 $C_{10} - C_{18}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基である。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項4】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピニルオキシ、ブチルオキシ、バネリルオキシ、ヒバニルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、 N -メチルカルバモイルオキシ、 N -エチルカルバモイルオキシ、 N -ジメチルカルバモイルオキシ又は N 、 N -ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_2$ アルキル基である。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項5】 R^1 が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基又は若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキ

シ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN、N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項6】R¹が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、2-ペバリジニル基又は1-メチル-2-ペバリジニル基である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項7】R¹が、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項8】R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇-C₈ アルキル基、ハロゲン-C₁-C₆ アルキル基、ヒドロキシ基、プトキシ基、C₇-C₈ アルコキシ基、C₇-C₈ アルコキシ基、C₃-C₆ アルケニル基、C₃-C₆ アルケニルオキシ基、C₃-C₆ アルキニル基、C₃-C₆ アルキニルオキシ

基、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいC₆-C₁₀アリール基又はC₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいC₆-C₁₀アリールオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいフェニル環を形成する基である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項9】R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇ アルキル基、弗素で置換されたC₁-C₄ アルキル基、ヒドロキシ基、プトキシ基、C₇-C₈ アルコキシ基、弗素で置換されたC₁-C₄ アルコキシ基、C₃-C₄ アルケニル基、C₃-C₄ アルケニルオキシ基、C₃-C₄ アルキニル基、C₃-C₄ アルキニルオキシ基、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいフェニル基、ナフチル基、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項10】R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、プトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、C₁-C₂ アルキル、C₁-C₂ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているもよいフェニル基、ナフチル基、C₁-C₂ アルキル、C₁-C₂ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₂ アルキル、C₁-C₂ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているもよいフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項11】R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているもよいフェニル基又はメチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているもよいフェノキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項12】R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₄ アルキル基、ハロゲンC₁-C₂ アルキル基、C₃-C₄ アルケニル基、C₃-C₄

4 アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_2$ アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基または $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項13】 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なつて、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロもしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパルギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項14】 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なつて、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項15】 R^{3a} 及び R^{3b} が、同一または異なつて、水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロエトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ基であり、 R^{3c} 及び R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項16】Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項17】Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項18】Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項19】Aが、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項20】1-メチル-2-[2-(4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]ピロリジン、2-[2-[4-(4-フルオロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[4-(4-クロロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(4-フルオロフェニル)エチル]-4-フェニル]フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)エチル]-4-フェニル]フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、

N,N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン、

N,N-ジメチル-3-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン、

N,N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン、

N,N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン及びN,N-ジメチル-4-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]ブチルアミンからなる群から選択されるフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項21】請求項1乃至20のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩を有効成分として含有する循環器疾患治療剤又は予防剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は優れたセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレニンシタゼ阻害作用を併せ持ち、循環器疾患（血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症疾患、特に、血栓性疾患）の治療剤もしくは予防剤として、有用なフェノキシアルキルアミン類もしくはその薬理上許容される塩又はそれらを有効成分とするセロトニン2受容体拮抗剤、スクアレニンシタゼ阻害剤もしくは循環器疾患（血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症疾患、特に、血栓性疾患）の治療剤もしくは予防剤に関する。

【0002】

【従来の技術】セロトニンは、古典的にはオータコイドに分類され、神経伝達物質としても知られており、生体内に於いては種々の受容体をいかに多彩な生理作用を示す。このセロトニンの受容体にはサブタイプが存在することが知られているが、循環器系においては、血管内皮細胞や血小板にセロトニン2受容体に分類される受容体が分布し、血管の収縮や血小板の凝集に深く関与しており（例えば、エス・ジェイ・ペロウトカ等；フェデレー

ション・プロシーディング、第42巻、第213頁(1983年): S. J. Peroutka et al., Fed. Proc., 42, 213 (1983)]、その拮抗薬は、血管収縮の防止や血小板凝集阻止に役立つ。現在、セロトニン2受容体拮抗薬として、ケタンセリンが知られているが[例えば、ジェイ・アイ・エス・ロバートソン; カレント・オピニオン・イン・カルディオロジー、第3巻、第702頁(1988年); J. T. S. Robertson, Curr. Opin. Cardiol., 3, 702 (1988)]、この薬剤はアドレナリン α 1拮抗薬として開発されたもので、強い血圧降下作用を示すという欠点を有する。又、最近、アドレナリン α 1拮抗作用が弱く、すぐれたセロトニン2受容体拮抗作用を有する血小板凝集阻害薬として、ジアリールアルカン誘導体が知られているが[例えば、ジャーナル・オブ・メディカル・ケミストリー、第35巻、第189頁(1992年)、同、第33巻、第1818頁(1990年)等; J. Med. Chem., 35, 189 (1992), ibid., 33, 1818 (1990)、特開平6-234736号公報、特開平6-306025号公報等]、これらの化合物がスクアレンシンターゼ阻害作用を有することは全く知られていない。

【0003】一方、高脂血症は動脈硬化症のような虚血性疾患の三大危険因子の一つであり、とりわけ高い血中コレステロール値を下げるのが心臓病の予防にすることが認められている。スクアレンシンターゼは、コレステロール合成系において、HMG-C_oA還元酵素の数段階下流に位置し、この段階以降コレステロール合成系は他のイソプレノ由来の化合物合成系とは経路を別にする。すなわち、スクアレンシンターゼを阻害するとユビキリンやドリコールなどの生合成を阻害することなく、コレステロールの生合成を抑制することが可能であり[例えば、ネイチャー、第343巻、第425頁(1990年); Nature, 343, 425 (1990)]、スクアレンシンターゼ阻害薬は高脂血症治療剤として極めて有用である。なお、スクアレンシンターゼ阻害剤としては、これまで、イソプレノイド(ホイフィニルズ)ホスフェート、ジオキサジシクロオクタン環を基本骨格に持つザラゴジックアシッド(Zaragolic Acids)等が知られている(米国特許第4,871,721号、米国特許第5,102,907号等)。

【0004】したがって、セロトニン2受容体拮抗作用およびスクアレンシンターゼ阻害作用を併せ持つ化合物は、スクアレンシンターゼ阻害作用による抗高脂血症作用に基づき、動脈硬化の発生、進展を予防、阻止するのみならず、セロトニン2受容体拮抗作用に基づく動脈硬化症における血栓形成を阻害し、また血管収縮を抑えることにより循環動態を改善し、これら疾患の予防、治

療作用が期待される。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】本発明者等は、フェノキシアールキアミン誘導体の薬理活性について、永年に亘り鋭意研究を行なった結果、特定のフェノキシアールキアミン類がセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であること、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤又は予防剤として有用であること、コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤又は予防剤として有用であること及びセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤又は予防剤として有用であることを見出し、本発明を完成するに至った。

【0006】

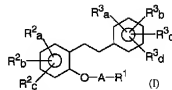
本発明は、フェノキシアールキアミン類もしくはその薬理上許容される塩、それらを有効成分とする循環器疾患(血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症疾患、特に、血栓性疾患)の治療剤もしくは予防剤を提供する。

【0007】

【課題を解決するための手段】本発明のフェノキシアールキアミン類は、一般式

【0008】

【化2】



【0009】を有する。

【0010】上記式中、R¹は、アミノ基、モノ一若しくはジ-C₁-C₆アルキルアミノ基又は置換されているもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基(該置換基は、炭素原子上の置換基は、ヒドロキシ基、C₁-C₂₀アルコキシカルボニルオキシ基、C₁-C₂₀アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換されたC₂-C₇アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ一若しくはジ-C₁-C₆アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基は、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいC₆-C₁₀アリールで置換されたC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているもよいC₆-C₁₀アリール基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、同一又は異なって、水素原子、C₇-C₁₀アルキル基、ハロゲン-C₁-C₁₀アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、C₇-C

1_0 アルコキシ基、ハロゲン- C_1 - C_{10} アルコキシ基、 C_2 - C_{10} アルケニル基、 C_3 - C_{10} アルケニルオキシ基、 C_2 - C_{10} アルキニル基、 C_3 - C_{10} アルキニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基もしくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリール基又は C_1 - C アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリールオキシ基を示すか、或は R^2a 、 R^2b 及び R^2c から選択される 2 個の基がそれらと結合している炭素原子と共に C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、 R^2a 、 R^2b 、 R^2c および R^2d は、同一又は異なって、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロゲン- C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロゲン- C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基又は C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリール基を示し、A は、単結合又は C_1 - C_6 アルキレン基を示す。但し、 R^1 がアミノ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルアミノ基である場合は、A は C_2 - C_6 アルキレン基を示し、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c の 1 個は、水素原子以外の基を示す。) を有する基を示す。

【0011】上記一般式 (1) において、 R^1 等に含まれる C_1 - C_6 アルキル基或は R^1 等に含まれるモノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルカルバモイルオキシ基又は C_1 - C_6 アルコキシ基等の C_1 - C_6 アルキル部分は、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル基であり得、好適には、 C_1 - C_4 アルキル基であり、更に好適には、メチル基又はエチル基であり、最も好適には、メチル基である。

【0012】 R^1 の置換された、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 乃至 2 個含む 3 乃至 6 員環状飽和ヘテロシクリル基の飽和ヘテロシクリル部分は、例えば、アジリジン、アゼチジン、ピロリジン、ペリリジン、ピペラジン、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジン、ピラゾリジン、トリアジン又はテトラゾリニル基であり得、好適には、アゼチジン、ピロリジン、ペリリジン、モルホリニル又はチオモルホリニル基であり、更に好適には、ピロリジン、ペリリジン又はモルホリニル基であり、更に好適には、2-ピロリジン又は 3-ペリリジン基であり、最も好適には、2-ピロリジン基である。また、 R^1 の置換された、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 乃至 2 個含む 3 乃至 6 員環状飽和ヘテロシクリル基は、好

適には、その炭素原子で、式-A-を有する基と結合している。

【0013】 R^1 に含まれる C_1 - C_{20} アルコシカルボニルオキシ基の C_1 - C_{20} アルコキシ部分は、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ、デシルオキシ、ウンデシルオキシ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、ヘプタデシルオキシ、オクタデシルオキシ、ノナデシルオキシ、エイコシルオキシ基であり得、好適には、 C_1 - C_6 又は C_8 - C_{18} アルコキシ基であり、更に好適には、 C_1 - C_4 又は C_8 - C_{18} アルコキシ基であり、更に好適には、エトキシ、イソプロポキシ、t-ブトキシ、オクチルオキシ、ヘキサデシルオキシ又はオクタデシルオキシ基であり、更に好適には、エトキシ基、イソプロポキシ基、t-ブトキシ、オクチルオキシ又はヘキサデシルオキシ基であり、最も好適には、オクチルオキシ基である。

【0014】 R^1 に含まれる C_1 - C_{20} アルカノイルオキシ基の C_1 - C_{20} アルカノイル部分は、例えば、後述する C_1 - C_6 アルカノイル基、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、ステアロイル、エイコサノイル、ドコサノイル基であり得、好適には、 C_2 - C_6 アルカノイル基又は C_{10} - C_{18} アルカノイル基であり、更に好適には、 C_2 - C_3 アルカノイル基又は C_{10} - C_{16} アルカノイル基であり、更に好適には、デカノイル基、ラウロイル基、ミリストイル基又はパルミトイル基であり、最も好適には、デカノイル基又はラウロイル基である。

【0015】 R^1 に含まれるカルボキシで置換された C_2 - C_7 アルカノイル基は、例えば、マロニル、スクシニル、グルタリル、アジポイル、ピメロイル、スベロイル基であり得、好適には、 C_3 - C_6 アルカノイル基であり、更に好適には、スクシニル又はグルタリル基であり、最も好適にはスクシニル基である。

【0016】 R^1 等に含まれるハロゲン原子は、例えば、弗素、塩素、臭素、沃素原子であり得、好適には、弗素、塩素又は臭素原子であり、更に好適には、弗素又は塩素原子である。

【0017】 R^1 に含まれる C_6 - C_{10} アリールで置換された C_1 - C_6 アルキル基は、1 乃至 3 個の C_6 - C_{10} アリールがアルキル基に置換されていてもよく、例えば、ベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、プロモベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、ペンツヒドリル、メチルペンツヒドリル、メトキシペンツ

ヒドリル、フルオロベンツヒドリル、クロロベンツヒドリル、ジフルオロベンツヒドリル、ジクロロベンツヒドリル、トリチル基であり得、好適には、ベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、ブロモベンジル、フェニル基又はベンツヒドリル基であり、最も好適には、ベンジル基である。

【0018】 R^1 に含まれる C_6-C_{10} アリール基、 R^{2a} 等の C_6-C_{10} アリール基又は R^{2a} 等の C_6-C_{10} アリールオキシ基のアリール部分等は、例えば、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ブロモフェニル、ナフチル、メチルナフチル又はメトキシナフチル基であり得、好適には、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル又はナフチル基であり、最も好適には、フェニル基である。

【0019】 R^1 に含まれる窒素原子の置換基である C_1-C_9 アルコキシカルボニル基の C_1-C_9 アルコキシ部分は、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ基であり得、好適には、 C_1-C_4 アルコキシ基、ヘプチルオキシ基又はオクチルオキシ基であり、更に好適には、 C_1-C_2 アルコキシ基又はオクチルオキシ基であり、最も好適には、メトキシ基である。

【0020】 R^{2a} 等の C_7-C_{10} アルキル基又は C_7-C_{10} アルコキシ基のアルキル部分は、例えば、ヘプチル、イソヘプチル、オクチル、ノニル、デシル基であり得、好適には、 C_7-C_8 アルキル基であり、最も好適には、ヘプチル基である。

【0021】 R^{2a} 等のハロゲノ- C_1-C_{10} アルキル基又はハロゲノ- C_1-C_{10} アルコキシ基のハロゲノ-アルキル部分は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル、6-フルオロヘキシル、7-フルオロヘプチル、8-フルオロオクチル、9-フルオロノニル、10-フルオロデシル基であり得、好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル又は6-フルオロヘキシル基であり、更に好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、特に好適には、トリフルオロメチル基である。

【0022】 R^{2a} 等の C_2-C_{10} アルケニル基は、例えば、ビニル、アリル、メタアリル、2-ブテンニル、2-ペンテンニル、2-ヘキセニル、2-ヘプテンニル、2-オ-

クテニル、2-ノネニル、2-オクテニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、最も好適には、アリル基である。

【0023】 R^{2a} 等の C_3-C_{10} アルケニルオキシ基のアルケニル部分は、例えば、アリル、メタアリル、2-ブテンニル、2-ペンテンニル、2-ヘキセニル、2-ヘプテンニル、2-オクテニル、2-ノネニル、2-オクテニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、最も好適には、アリル基である。

【0024】 R^{2a} 等の C_2-C_{10} アルキニル基は、例えば、エチニル、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル、2-ヘプテニル、2-オクチニル、2-ノニルニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルキニル基であり、最も好適には、プロパルギル基である。

【0025】 R^{2a} 等の C_3-C_{10} アルキニルオキシ基のアルキニル部分は、例えば、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル、2-ヘプテニル、2-オクチニル、2-ノニルニル、2-デシルニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルキニル基であり、最も好適には、プロパルギル基である。

【0026】 R^{2a} 等が形成する置換されていてもよいフェニル環は、例えば、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル又はブロモフェニル環であり得、好適には、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル又はクロロフェニル環であり、最も好適には、フェニル環である。

【0027】 R^{2a} 等のハロゲノ- C_1-C_6 アルキル基は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル、6-フルオロヘキシル基であり得、好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、更に好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、特に好適には、トリフルオロメチル基である。

【0028】 R^{2a} 等の C_2-C_6 アルケニル基は、例えば、ビニル、アリル、メタアリル、2-ブテンニル、2-ペンテンニル、2-ヘキセニル基であり得、好適には、 C_3-C_4 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、特に好適には、アリル基である。

【0029】 R^{2a} 等の C_2-C_6 アルキニル基は、例え

ば、エチニル、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル基であり得、好適には、 C_3 - C_4 アルキル基であり、特に好適には、プロパルギル基である。

【0030】 R^3 等のハロゲン- C_1 - C_6 アルコキシ基は、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、3-フルオロプロポキシ、4-フルオロプロポキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ基であり得、好適には、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ又は2-クロロエトキシ基であり、更に好適には、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ又は2-クロロエトキシ基であり、最も好適には、フルオロメトキシ基又は2-フルオロエトキシ基である。

【0031】 A の C_1 - C_6 アルキレン基は、例えば、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基であり得、好適には、 C_1 - C_4 アルキレン基であり、更に好適には、メチレン、エチレン又はトリメチレン基であり、最も好適には、エチレン又はトリメチレン基である。

【0032】また、 R^1 の5乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基の環上の置換基は、炭素原子上の置換基として、好適には、ヒドロキシ基、 C_1 - C_{18} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_1 - C_{20} アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された C_3 - C_7 アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_2 アルキルカルバモイル基であり、さらに好適には、ヒドロキシ基、 C_1 - C_4 アルコキシカルボニルオキシ基、 C_8 - C_{16} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_2 - C_5 アルカノイルオキシ基、 C_{10} - C_{18} アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された C_3 - C_6 アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_2 アルキルカルバモイルオキシ基であり、更に好適には、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチルオキシ、パレイルオキシ、ピバロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリスチルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、 N -メチルカルバモイルオキシ、 N -エチルカルバモイルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ

基であり、更にまたより好適には、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリスチルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ基であり、特に好適には、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、スクシニルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ基であり、最も好適には、ヒドロキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ又はパルミトイルオキシ基であり、また、窒素原子上の置換基として、好適には、 C_1 - C_4 アルキル基又はメチル、メトキシ、フルオロ若しくはクロロで置換されてもよいフエニル基であり、更に好適には、 C_1 - C_4 アルキル基であり、更により好適には C_1 - C_2 アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

【0033】更にまた、 R^1 の窒素、酸素若しくは硫黄原子を含む5乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基の具体的なものは、例えば、ピロリジニル、1-メチルピロリジニル、1-エチルピロリジニル、1-プロピルピロリジニル、1-イソプロピルピロリジニル、1-ブチルピロリジニル、1-ペンチルピロリジニル、1-ヘキシルピロリジニル、ヒドロキシピロリジニル、メトキシカルボニルオキシピロリジニル、エトキシカルボニルオキシピロリジニル、プロポキシカルボニルオキシピロリジニル、イソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、 t -ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、ペンチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘキシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、オクチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ノニルオキシカルボニルオキシピロリジニル、デシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ウンデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ドデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、トリデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ペンタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘプタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、オクタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ホルミルオキシピロリジニル、アセトキシピロリジニル、プロピオニルオキシピロリジニル、ブチルオキシピロリジニル、パレイルオキシピロリジニル、ピバロイルオキシピロリジニル、ヘキサノイルオキシピロリジニル、3、3-ジメチルブチルオキシピロリジニル、ヘプタノイルオキシピロリジニル、オクタノイルオキシピロリジニル、ノナノイルオキシピロリジニル、デカノイルオキシピロリジニル、ウン

リジニル、1-メチル-デシルオキシカルボニルオキシ
ピロリジニル、1-メチル-ヘキサデシルオキシカルボ
ニルオキシピロリジニル、1-メチル-オクタデシルオ
キシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチル-アセ
トキシピロリジニル、1-メチル-プロピオニルオキシ
ピロリジニル、1-メチル-バレリルオキシピロリジニ
ル、1-メチル-ピバロイルオキシピロリジニル、1-
メチル-デカノイルオキシピロリジニル、1-メチル-
ウンデカノイルオキシピロリジニル、1-メチル-ラウ
ロイルオキシピロリジニル、1-メチル-ミリストイル
オキシピロリジニル、1-メチル-パルミトイルオキシ
ピロリジニル、1-メチル-ステアロイルオキシピロリ
ジニル、1-メチル-スクシニルオキハビロリジニル、
1-メチル-グルタリルオキシピロリジニル、1-メチ
ル-カルバモイルオキシピロリジニル、1-メチル-N
-メチルカルバモイルオキシピロリジニル、1-メチル
-N、N-ジメチルカルバモイルオキシピロリジニル、
1-エチル-ヒドロキシピロリジニル、1-エチル-メ
トキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチル-エ
トキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチル-イ
ソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチ
ル-tert-ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、1-
エチル-オクチルオキシカルボニルオキシピロリジ
ニル、1-エチル-ノニルオキシカルボニルオキシピロ
リジニル、1-エチル-ヘキサデシルオキシカルボニ
ルオキシピロリジニル、1-エチル-オクタデシルオキ
シカルボニルオキシピロリジニル、1-エチル-アセ
トキシピロリジニル、1-エチル-プロピオニルオキシ
ピロリジニル、1-エチル-バレリルオキシピロリジ
ニル、1-エチル-ピバロイルオキシピロリジニル、1-
エチル-ラウロイルオキシピロリジニル、1-エチル-
ミリストイルオキシピロリジニル、1-エチル-パルミ
トイルオキシピロリジニル、1-エチル-ステアロイ
ルオキシピロリジニル、1-エチル-スクシニルオキシ
ピロリジニル、1-エチル-グルタリルオキシピロリジ
ニル、1-エチル-カルバモイルオキシピロリジニル、
ピベリジニル、1-メチルピベリジニル、1-エチルピ
ベリジニル、ヒドロキシベリジニル、メトキシカルボ
ニルオキシベリジニル、エトキシカルボニルオキシベ
リジニル、イソプロポキシカルボニルオキシベリジ
ニル、tert-ブトキシカルボニルオキシベリジニル、オ
クチルオキシカルボニルオキシベリジニル、デシルオ
キシカルボニルオキシベリジニル、ヘキサデシルオキ
シカルボニルオキシベリジニル、オクタデシルオキシ
カルボニルオキシベリジニル、アセトキシベリジ
ニル、プロピオニルオキシベリジニル、バレリルオキ
シベリジニル、ピバロイルオキシベリジニル、デカノ
イルオキシベリジニル、ウンデカノイルオキシベリ
ジニル、ラウロイルオキシベリジニル、ミリストイル

オキシベリジニル、パルミトイルオキシベリジニ
ル、ステアロイルオキシベリジニル、スクシニルオキ
シベリジニル、グルタリルオキシベリジニル、カル
バモイルオキシベリジニル、N-メチルカルバモイ
ルオキシベリジニル、N、N-ジメチルカルバモイ
ルオキシベリジニル、1-メチル-ヒドロキシベリジ
ニル、1-メチル-メトキシカルボニルオキシベリジ
ニル、1-メチル-エトキシカルボニルオキシベリジ
ニル、1-メチル-イソプロポキシカルボニルオキシベ
リジニル、1-メチル-tert-ブトキシカルボニルオキ
シベリジニル、1-メチル-オクチルオキシカルボニ
ルオキシベリジニル、1-メチル-デシルオキシカルボ
ニルオキシベリジニル、1-メチル-ヘキサデシル
オキシカルボニルオキシベリジニル、1-メチル-オ
クタデシルオキシカルボニルオキシベリジニル、1-
メチル-アセトキシベリジニル、1-メチル-プロピ
オニルオキシベリジニル、1-メチル-バレリルオキ
シベリジニル、1-メチル-ピバロイルオキシベリジ
ニル、1-メチル-デカノイルオキシベリジニル、1-
メチル-ウンデカノイルオキシベリジニル、1-メ
チル-ラウロイルオキシベリジニル、1-メチル-ミ
リストイルオキシベリジニル、1-メチル-パルミ
トイルオキシベリジニル、1-メチル-ステアロイル
オキシベリジニル、1-メチル-スクシニルオキシベ
リジニル、1-メチル-グルタリルオキシベリジニ
ル、1-メチル-カルバモイルオキシベリジニル、1-
メチル-N、N-ジメチルカルバモイルオキシベリ
ジニル、1-エチル-ヒドロキシベリジニル、1-エ
チル-メトキシカルボニルオキシベリジニル、1-エ
チル-エトキシカルボニルオキシベリジニル、1-エ
チル-イソプロポキシカルボニルオキシベリジニル、
1-エチル-tert-ブトキシカルボニルオキシベリジ
ニル、1-エチル-オクチルオキシカルボニルオキシ
ベリジニル、1-エチル-デシルオキシカルボニルオ
キシベリジニル、1-エチル-ヘキサデシルオキシカル
ボニルオキシベリジニル、1-エチル-オクタデシル
オキシカルボニルオキシベリジニル、1-エチル-ア
セトキシベリジニル、1-エチル-プロピオニルオキ
シベリジニル、1-エチル-バレリルオキシベリジ
ニル、1-エチル-ピバロイルオキシベリジニル、1-
エチル-デカノイルオキシベリジニル、1-エチル-
ラウロイルオキシベリジニル、1-エチル-ミスト
イルオキシベリジニル、1-エチル-パルミトイル
オキシベリジニル、1-エチル-ステアロイルオキシ
ベリジニル、1-エチル-スクシニルオキシベリジ
ニル、1-エチル-グルタリルオキシベリジニル、1-
エチル-カルバモイルオキシベリジニル、モルホリ
ニル、4-メチルモルホリニル又は4-エチルモルホ
ニル基であり、更に好適には、2-ピロリジニル、3-ピ
ロリジニル、1-メチル-2-ピロリジニル、1-メチ

ル-3ービロリジニル、4ーヒドロキシ-2ービロリジニル、4ーエトキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーイソプロボキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ー α -ブトキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーオクチルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーヘキサデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーオクタデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、4ーアセトキシ-2ービロリジニル、4ープロピオンオキシ-2ービロリジニル、4ーバレリルオキシ-2ービロリジニル、4ーイソバロイルオキシ-2ービロリジニル、4ーデカノイルオキシ-2ービロリジニル、4ーラウロイルオキシ-2ービロリジニル、4ーミリスティルオキシ-2ービロリジニル、4ーパルミトイルオキシ-2ービロリジニル、4ーステアロイルオキシ-2ービロリジニル、4ースクシニルオキシ-2ービロリジニル、4ーグルタリルオキシ-2ービロリジニル、4ーカルバモイルオキシ-2ービロリジニル、4ーN-メチルカルバモイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーヒドロキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーエトキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーイソプロボキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ー α -ブトキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーオクチルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーヘキサデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーオクタデシルオキシカルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーアセトキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ープロピオンオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーバレリルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーイソバロイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーデカノイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーラウロイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーミリスティルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーパルミトイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーステアロイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ースクシニルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーグルタリルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーカルバモイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーN-メチルカルバモイルオキシ-2ービロリジニル、1ーメチル-4ーN、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2ービロリジニル、1ーエチル-4ーヒドロキシ-2ービロリジニル、1ーエチル-4ーエトキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーエチル-4ーイソプロボキシルポニルオキシ-2ービロリジニル、1ーエチル-4ー α -ブトキシルポニルオキシ-

2-ビロリジニル、1-エチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-オクタデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-アセトキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-ミリストイルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-パルミトイルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-ステアロイルオキシ-2-ビロリジニル、1-エチル-4-スクニルオキシ-2-ビロリジニル、2-ビペリジニル、3-ビペリジニル、4-ビペリジニル、1-メチル-2-ビペリジニル、1-メチル-3-ビペリジニル、1-メチル-4-ビペリジニル、4-ヒドロキシ-2-ビペリジニル又は1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ビペリジニル基であり、更に以下好適には、2-ビロリジニル、3-ビロリジニル、1-メチル-2-ビロリジニル、4-ヒドロキシ-2-ビロリジニル、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-tert-ブトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-オクタデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、4-アセトキシ-2-ビロリジニル、4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル、4-デカノイミリキシ-2-ビロリジニル、4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル、4-ミリストイルオキシ-2-ビロリジニル、4-パルミトイルオキシ-2-ビロリジニル、4-ステアロイルオキシ-2-ビロリジニル、4-スクニルオキシ-2-ビロリジニル、4-カルバモイルオキシ-2-ビロリジニル、4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-tert-ブトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-オクタデシルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-アセトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-ミリストイルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ビロリジニル、1-メチル-4-ステアロイルオキシ-2-ビロリジニル、1-

メチル-4-スチルニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-カルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-N,N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、2-ビベリジニル、3-ビベリジニル、4-ビベリジニル、1-メチル-2-ビベリジニル、1-メチル-3-ビベリジニル又は1-メチル-4-ビベリジニル基であり、特に好適には、2-ピロリジニル、1-メチル-2-ピロリジニル、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-tertブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル、4-スチルニルオキシ-2-ピロリジニル、4-N,N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-tertブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-N,N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、2-ビベリジニル又は1-メチル-2-ビベリジニル基であり、最も好適には、2-ピロリジニル、1-メチル-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基である。

【0034】本発明の化合物(1)は、常法に従って酸と処理することより、相当する系上許容し得る酸付加塩に変えることができる。このような酸付加塩の例としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸等の無機酸、酢酸、安息香酸、シュウ酸、マレイン酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸等の有機酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸による付加塩があげられる。

【0035】更に、化合物(1)の分子内に不斉炭素が存在する場合は、ラセミ体および光学活性体(好適には、2R-体)を包含し、化合物(1)又はその塩の水和物も包含する。

【0036】一般式(1)を有する化合物において、好適には、(1)R¹が、ジ-C₁-C₆アルキルアミノ

基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基、ビベリジニル基若しくはモルホリニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、C₁-C₁₈アルコキシカルボニルオキシ基、C₁-C₂₀アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換されたC₃-C₆アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ-C₁-C₂アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、C₁-C₄アルキル基又はメチル、メトキシ、ホスホ若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。)である化合物、(2)R¹が、ジ-C₁-C₄アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはビベリジニル基

(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、C₁-C₄アルコキシカルボニルオキシ基、C₈-C₁₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₂-C₆アルカノイルオキシ基、C₁₀-C₁₈アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換されたC₃-C₆アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ-C₁-C₂アルキルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、C₁-C₄アルキル基である。)である化合物、(3)R¹が、ジ-C₁-C₂アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはビベリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、tertブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチルオキシ、パレイルオキシ、

ビパロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリスチルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、N-メチルカルバモイルオキシ、N-エチルカルバモイルオキシ、N,N-ジメチルカルバモイルオキシ又はN,N-ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、C₁-C₂アルキル基である。)である化合物、(4)R¹が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基又は若しくはビベリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、tertブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN,N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)である化合物、

(5)R¹が、ジメチルアミノ基、2-ビベリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ

-2-ビロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ビロリジニル基、4-ステアリン酸オキシ-2-ビロリジニル基、4-N, N-ジメチル-カルバモイルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-ステアリン酸オキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ビロリジニル基、2-ビペリジニル基又は1-メチル-2-ビペリジニル基である化合物、(6) R²が、2-ビロリジニル基、1-メチル-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ビロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ビロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ビロリジニル基である化合物、
 (7) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇-C₈ アルキル基、ハロゲン-C₁-C₆ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、C₇-C₈ アルコキシ基、ハロゲン-C₁-C₆ アルコキシ基、C₃-C₉ アルケニル基、C₃-C₆ アルケニルオキシ基、C₃-C₉ アルキニル基、C₃-C₆ アルキニルオキシ基、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているC₆-C₁₀ アリール基又はC₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているC₆-C₁₀ アリールオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているC₆-C₁₀ アリール環を形成する基である化合物、(8) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇-C₈ アルキル基、弗素で置換されたC₁-C₄ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、C₇-C₈ アルコキシ基、弗素で置換されたC₁-C₄ アルコキシ基、C₃-C₉ アルケニル基、C₃-C₆ アルケニルオキシ基、C₃-C₉ アルキニル基、C₃-C₆ アルキニルオキシ基、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ若しくはハロゲンで置換

されているC₆-C₁₀ アリール環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、
 (9) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、ブトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリールオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、C₁-C₂ アルキル、C₁-C₂ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているC₆-C₁₀ アリール環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子若しくは塩素原子で置換されているC₆-C₁₀ アリール環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、
 (10) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されているC₆-C₁₀ アリール環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、
 (11) R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₄ アルキル基、ハロゲン-C₁-C₂ アルキル基、C₃-C₄ アルケニル基、C₃-C₄ アルキニル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロゲン-C₁-C₂ アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基またはC₁-C₂ アルキル、C₁-C₂ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されているC₆-C₁₀ アリール環であり、R^{2d}が、水素原子である化合物、(12) R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₂ アルキル基、フルオロもしくはクロロ-C₁-C₂ アルキル基、アリル基、プロパギル基、C₁-C₂ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されているC₆-C₁₀ アリール環であり、R^{2d}が、水素原子である化合物、(13) R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₂ アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、C₁-C₂ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、R^{2d}が、水素原子である化合物、(14) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原

子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ基であり、 R^3c 及び R^3d が、水素原子である化合物、(15) Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキル基である化合物、(16) Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(17) Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物又は(18) Aが、エチレン基又はトリメチレン基である化合物をあげることができる。尚、(1)乃至(6)群、(7)乃至(10)群、(11)乃至(14)群及び(15)乃至(18)群については、群番号が大きくなるにつれて、より好適なものを示す。

【0037】又、 R^1 を(1) - (6)から選択し、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} を(7) - (10)から選択し、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 及び R^{3d} を(11) - (14)から選択し、Aを(15) - (18)から選択し、それらを任意に組み合わせたものも好適であり、例えば、以下のものを挙げることができる。

【0038】(19) R^1 が、ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ビロリジニル基、ピベリジニル基若しくはモルホリニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{18}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- $C_1 - C_6$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。)であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なっており、水素原子、 $C_7 - C_{18}$ アルキル基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルキル基、ヒドロキシ基、プトキシ基、 $C_7 - C_8$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニル基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニル基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なっており、水素原子、 $C_1 - C_4$ アルキル基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_6$ アルコキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニル基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニル基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_6$ アルコキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニル基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニル基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{3d} が、水素原子であり、Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(21) R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ビロリジニル基若しくはピベリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 α -ブトキシカルボニルオキシ、 α -ペンチルオキシカルボニルオキシ、 α -ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、 α -セトキシ、 α -プロピニルオキシ、 β -チリルオキシ、 β -バロイルオキシ、 β -パロイルオキシ、 β -デカノイルオキシ、 β -ウンデカノイルオキシ、 β -ラウロイルオキシ、 β -ミリスチルオキシ、 β -パルミトイルオキシ、 β -ステアロイルオキシ、 β -スクニルオキシ、 β -グルタリルオキシ、 β -カルバモイルオキシ、 β -N-メチルカルバモイルオキシ、 β -N-エチルカルバモイルオキシ、 β -N、N-

あり、 R^{3d} が、水素原子であり、Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキル基である化合物、(20) R^1 が、ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ビロリジニル基若しくはピベリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニルオキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{2c} が、水素原子であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なっており、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロ-もしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパルギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子であり、Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、

(21) R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ビロリジニル基若しくはピベリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 α -ブトキシカルボニルオキシ、 α -ペンチルオキシカルボニルオキシ、 α -ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、 α -セトキシ、 α -プロピニルオキシ、 β -チリルオキシ、 β -バロイルオキシ、 β -パロイルオキシ、 β -デカノイルオキシ、 β -ウンデカノイルオキシ、 β -ラウロイルオキシ、 β -ミリスチルオキシ、 β -パルミトイルオキシ、 β -ステアロイルオキシ、 β -スクニルオキシ、 β -グルタリルオキシ、 β -カルバモイルオキシ、 β -N-メチルカルバモイルオキシ、 β -N-エチルカルバモイルオキシ、 β -N、N-

ジメチルカルバモイルオキシ又はN、N-ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_2$ アルキル基である。)であり、 R^2a 及び R^2b が、同一または異なっており、水素原子、 C_7 アルキル基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルキル基、ヒドロキシ基、プトキシ基、 $C_7 - C_8$ アルコキシ基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルコキシ基、 $C_3 - C_4$ アルケニル基、 $C_3 - C_4$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_4$ アルキニル基、 $C_3 - C_4$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子であり、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c が、同一または異なっており、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロもしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、クロロメチル基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^3d が、水素原子であり、Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(22) R^1 が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN、N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)であり、 R^2a 及び R^2b が、同一または異なっており、水素原子、ヒドロキシ基、プトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロバギルオキシ基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子であり、 R^3a 、 R^3b 及び R^3c が、同一または異なっており、水素原子、 $C_1 - C_2$

アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^3d が、水素原子であり、Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(23) R^1 が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4- t -ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4- t -ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、2-ピペリジニル基又は1-メチル-2-ピペリジニル基であり、 R^2a 及び R^2b が、同一または異なっており、水素原子、ヒドロキシ基、プトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロバギルオキシ基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子であり、 R^3a 、 R^3b 及び R^3c が、同一または異なっており、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^3d が、水素原子

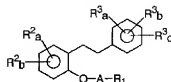
であり、Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(24) R¹ が、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクタルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基であり、R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なつて、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基又はメチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子であり、R^{3a}及びR^{3b}が、同一または異なつて、水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ

基であり、R^{3c}及びR^{3d}が、水素原子であり、Aが、エチレン基又はトリメチレン基である化合物。

【0039】一般式(1)における好適な化合物として、次の表1に示す化合物を具体的に例示することができる。なお、下記化3の化合物は、化合物(1)において、R^{2c}及びR^{3d}が水素原子の化合物である。

【0040】

【化3】



【0041】

【表1】

例示化合物

番号	No.	-A-R ¹	R ^{2a} & R ^{2b}	R ^{3a} , R ^{3b} & R ^{3c}
1		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OC	H
2		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CF ₃	H
3		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OH	H
4		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	H
5		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₃ p	H
6		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OC	H
7		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OCF ₃	H
8		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
9		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
10		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ C≡CH	H
11		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	H
12		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	H
13		CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-Ph	H
14		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	H
15		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Me-Ph)	H
16		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-OMe-Ph)	H
17		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-F-Ph)	H
18		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Cl-Ph)	H
19		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Me-Ph)	H
20		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-OMe-Ph)	H
21		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-F-Ph)	H
22		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Cl-Ph)	H
23		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	H
24		CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-OPh	H
25		CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	H
26		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O(4-Me-Ph)	H
27		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O(4-OMe-Ph)	H
28		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O(4-F-Ph)	H
29		CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O(4-Cl-Ph)	H

30	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O (4-Me-Ph)	H
31	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O (4-OMe-Ph)	H
32	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O (4-F-Ph)	H
33	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O (4-Cl-Ph)	H
34	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
35	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
36	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
37	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OH	H
38	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OBu	H
39	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OCc	H
40	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
41	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
42	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
43	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
44	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-Ph	H
45	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5-Ph	H
46	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6-Ph	H
47	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OPh	H
48	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5-OPh	H
49	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6-OPh	H
50	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
52	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
53	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Hp	H
54	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-CF ₃	H
55	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OH	H
56	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OBu	H
57	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OBu	H
58	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	H
59	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OCc	H
60	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OCF ₃	H
61	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
62	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
63	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
64	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
65	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	H
66	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-Ph	H
67	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	H
68	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- (4-Me-Ph)	H
69	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- (4-OMe-Ph)	H
70	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- (4-F-Ph)	H
71	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- (4-Cl-Ph)	H
72	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6- (4-Me-Ph)	H
73	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6- (4-OMe-Ph)	H
74	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6- (4-F-Ph)	H
75	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6- (4-Cl-Ph)	H
76	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	H
77	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-OPh	H
78	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OPh	H
79	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O- (4-Me-Ph)	H

80	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Me-Ph)	H
81	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-F-Ph)	H
82	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Cl-Ph)	H
83	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Me-Ph)	H
84	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Me-Ph)	H
85	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-F-Ph)	H
86	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Cl-Ph)	H
87	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
88	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
89	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
90	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OH	H
91	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OBu	H
92	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OCc	H
93	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
94	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
95	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
96	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
97	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	H
98	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-Ph	H
99	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-Ph	H
100	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OPh	H
101	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-OPh	H
102	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-OPh	H
103	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
104	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
105	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
106	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Hp	H
107	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-CF ₃	H
108	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OH	H
109	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OBu	H
110	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-OBu	H
111	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-CHp	H
112	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OCc	H
113	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OCF ₃	H
114	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
115	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
116	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
117	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
118	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	H
119	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5-Ph	H
120	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	H
121	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
122	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
123	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	H
124	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	H
125	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
126	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
127	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	H
128	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-Cl-Ph)	H
129	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	H

130	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5-OPh	H
131	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-OPh	H
132	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
133	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
134	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	H
135	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	H
136	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
137	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
138	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	H
140	CH_2CH_2 (2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
141	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
142	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
143	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
144	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
145	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
146	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
147	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OBu	H
148	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OHp	H
149	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
150	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
151	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
152	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
153	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
154	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
155	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
156	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
157	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
158	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
159	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
160	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	H
161	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	H
162	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
163	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
164	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	H
165	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	H
166	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
167	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
168	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
169	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
170	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
171	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	H
172	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	H
173	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
174	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
175	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	H
176	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	H
177	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
178	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
179	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
180	CH_2CH_2 (4-OH-2-Pyr)	4-OH	H

181	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OBu	H
182	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OOc	H
183	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
184	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
185	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-Ph	H
186	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-Ph	H
187	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-Ph	H
188	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OPh	H
189	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-OPh	H
190	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-OPh	H
191	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
192	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
193	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
194	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OH	H
195	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OBu	H
196	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OOc	H
197	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
198	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
199	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-Ph	H
200	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-Ph	H
201	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-Ph	H
202	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OPh	H
203	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-OPh	H
204	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-OPh	H
205	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
206	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
207	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
208	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OH	H
209	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OBu	H
210	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OOc	H
211	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
212	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
213	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-Ph	H
214	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-Ph	H
215	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-Ph	H
216	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OPh	H
217	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-OPh	H
218	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-OPh	H
219	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
220	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
221	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
222	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OH	H
223	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OBu	H
224	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OOc	H
225	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
226	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
227	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-Ph	H
228	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5-Ph	H
229	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	6-Ph	H
230	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OPh	H

231	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	5-OPh	H
232	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	6-OPh	H
233	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
234	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
235	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
236	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
237	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
238	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
239	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
240	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OBu	H
241	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OHp	H
242	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
243	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
244	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
245	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
246	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
247	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
248	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
249	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
250	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
251	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
252	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	H
253	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	H
254	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	H
255	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
256	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	H
257	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	H
258	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Cl-Ph)	H
259	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
260	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
261	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
262	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	H
263	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	H
264	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-F-Ph)	H
265	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Cl-Ph)	H
266	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	H
267	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	H
268	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-F-Ph)	H
269	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Cl-Ph)	H
270	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
271	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
272	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
273	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
274	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
275	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
276	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
277	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
278	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
279	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
280	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H

281	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
282	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-O-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
283	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
284	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
285	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
286	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
287	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	H
288	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
289	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	H
290	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
291	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
292	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
293	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	H
294	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	H
295	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	H
296	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	H
297	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH=CH=CH)-	H
298	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH=CH=CH)-	H
299	CH_2CH_2 (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH=CH=CH)-	H
300	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
301	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
302	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
303	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-CH}_2\text{CH=CH}_2$	H
304	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-O-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
305	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
306	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
307	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
308	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
309	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
310	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
311	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH=CH=CH)-	H
312	CH_2CH_2 (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH=CH=CH)-	H
314	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
315	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
316	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
317	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
318	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
319	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-CH}_2\text{CH=CH}_2$	H
320	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-O-CH}_2\text{CH=CH}_2$	H
321	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
322	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	$4\text{-O-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
323	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
324	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
325	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
326	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
327	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	H
328	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
329	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	H
330	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
331	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H

332	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
333	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
334	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
335	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
336	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
337	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH)-	H
338	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH)-	H
339	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH)-	H
340	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
341	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
342	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
343	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
344	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
345	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
346	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
347	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
348	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
349	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
350	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
351	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
352	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
353	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
354	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
355	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
356	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
357	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
358	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
359	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
360	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
361	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
362	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
363	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
364	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH)-	H
365	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH)-	H
366	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH)-	H
367	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
368	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
369	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
370	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
371	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
372	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
373	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
374	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
375	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
376	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
377	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
378	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH)-	H
379	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH)-	H
380	CH ₂ CH ₂ (4-OMYR-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH)-	H
381	CH ₂ CH ₂ (4-OPAL-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H

382	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
383	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
384	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
385	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
386	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
387	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
388	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
389	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
390	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
391	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
392	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
393	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
394	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
395	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
396	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
397	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
398	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
399	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
400	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
401	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
402	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
403	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
404	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
405	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
406	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
407	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
408	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
409	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
410	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
411	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
412	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
413	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
414	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
415	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
416	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
417	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
418	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
419	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
420	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
421	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
422	CH ₂ CH ₂ (4-OCOMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
423	CH ₂ (3-Pyr)	4-OH	H
424	CH ₂ (3-Pyr)	4-OBu	H
425	CH ₂ (3-Pyr)	4-OOc	H
426	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
427	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
428	CH ₂ (3-Pyr)	4-Ph	H
429	CH ₂ (3-Pyr)	5-Ph	H
430	CH ₂ (3-Pyr)	6-Ph	H
431	CH ₂ (3-Pyr)	4-OPh	H

432	CH ₂ (3-Pyr)	5-OPh	H
433	CH ₂ (3-Pyr)	6-OPh	H
434	CH ₂ (3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
435	CH ₂ (3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
436	CH ₂ (3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
437	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OH	H
438	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OBu	H
439	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OOc	H
440	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
441	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
442	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-Ph	H
443	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-Ph	H
444	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-Ph	H
445	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OPh	H
446	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-OPh	H
447	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-OPh	H
448	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
449	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
450	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
451	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OH	H
452	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OBu	H
453	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OOc	H
454	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
455	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
456	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-Ph	H
457	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-Ph	H
458	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-Ph	H
459	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OPh	H
460	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-OPh	H
461	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-OPh	H
462	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
463	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
464	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
465	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OH	H
466	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OBu	H
467	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OOc	H
468	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
469	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
470	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-Ph	H
471	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-Ph	H
472	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-Ph	H
473	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OPh	H
474	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-OPh	H
475	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-OPh	H
476	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
477	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
478	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
479	CH ₂ (3-Pip)	4-OH	H
480	CH ₂ (3-Pip)	4-OBu	H
481	CH ₂ (3-Pip)	4-OOc	H

482	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
483	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
484	CH ₂ (3-Pip)	4-Ph	H
485	CH ₂ (3-Pip)	5-Ph	H
486	CH ₂ (3-Pip)	6-Ph	H
487	CH ₂ (3-Pip)	4-OPh	H
4 8 8	CH ₂ (3-Pip)	5-OPh	H
489	CH ₂ (3-Pip)	6-OPh	H
490	CH ₂ (3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
491	CH ₂ (3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
492	CH ₂ (3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
493	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OH	H
494	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OBu	H
495	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OOC	H
496	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
497	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
498	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-Ph	H
499	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-Ph	H
500	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-Ph	H
501	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OPh	H
502	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-OPh	H
503	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-OPh	H
504	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
505	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
506	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
507	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Oc	3-OMe
508	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CF ₃	3-OMe
509	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OH	3-OMe
510	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	3-OMe
511	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	3-OMe
512	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OOC	3-OMe
513	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OCF ₃	3-OMe
514	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
515	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
517	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
518	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	3-OMe
519	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-Ph	3-OMe
520	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	3-OMe
521	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
522	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
523	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-F-Ph)	3-OMe
524	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
525	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
526	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
527	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-F-Ph)	3-OMe
528	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Cl-Ph)	3-OMe
529	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	3-OMe
530	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-OPh	3-OMe
531	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	3-OMe
532	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe

533	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
534	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-O-(4-F-Ph)	3-OMe
535	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
536	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
537	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
538	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O-(4-F-Ph)	3-OMe
539	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
540	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
541	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
542	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
543	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OH	3-OMe
544	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OBu	3-OMe
546	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
547	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
548	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
549	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
550	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-Ph	3-OMe
551	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5-Ph	3-OMe
552	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6-Ph	3-OMe
553	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-OPh	3-OMe
554	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5-OPh	3-OMe
555	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6-OPh	3-OMe
556	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
557	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
558	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
559	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Hp	3-OMe
560	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-CF ₃	3-OMe
561	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OH	3-OMe
562	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OBu	3-OMe
563	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OBu	3-OMe
564	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-OMe
565	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OOC	3-OMe
566	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OCF ₃	3-OMe
567	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
568	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
569	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
570	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
571	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-OMe
572	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-Ph	3-OMe
573	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	3-OMe
574	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
575	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
576	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-F-Ph)	3-OMe
577	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
578	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
579	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
580	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-F-Ph)	3-OMe
581	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-Cl-Ph)	3-OMe
582	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-OMe
583	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-OPh	3-OMe

584	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OPh	3-OMe
585	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
586	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
587	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-F-Ph)	3-OMe
588	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
589	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
590	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
591	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-F-Ph)	3-OMe
592	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
593	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
594	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
595	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
596	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OH	3-OMe
597	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OBu	3-OMe
598	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OOc	3-OMe
599	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
600	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
601	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
602	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
603	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	3-OMe
604	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-Ph	3-OMe
605	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-Ph	3-OMe
606	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OPh	3-OMe
607	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-OPh	3-OMe
608	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-OPh	3-OMe
609	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
610	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
611	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
612	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
613	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
614	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OH	3-OMe
615	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
616	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-OBu	3-OMe
617	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ohp	3-OMe
618	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
619	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
620	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
621	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3-OMe
622	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
623	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe
624	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
625	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
626	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
627	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
628	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
629	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	3-OMe
630	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
631	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
632	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
633	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	3-OMe

634	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	3-Ome
635	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	3-Ome
636	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5-OPh	3-Ome
637	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-OPh	3-Ome
638	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	3-Ome
639	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-Ome-Ph)	3-Ome
640	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	3-Ome
641	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	3-Ome
642	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	3-Ome
643	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-Ome-Ph)	3-Ome
644	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	3-Ome
645	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	3-Ome
646	CH_2CH_2 (2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
647	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
648	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
649	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-Ome
650	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-Ome
651	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-Ome
652	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-Ome
653	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OBu	3-Ome
654	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CHp	3-Ome
655	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OOC	3-Ome
656	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-Ome
657	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
658	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
659	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-Ome
660	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Ome
661	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Ome
662	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-Ome
663	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Ome
664	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	3-Ome
665	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Ome-Ph)	3-Ome
666	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	3-Ome
667	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	3-Ome
668	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	3-Ome
669	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Ome-Ph)	3-Ome
670	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	3-Ome
671	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	3-Ome
672	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Ome
673	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-Ome
674	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-Ome
675	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	3-Ome
676	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Ome-Ph)	3-Ome
677	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	3-Ome
678	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	3-Ome
679	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	3-Ome
680	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Ome-Ph)	3-Ome
681	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	3-Ome
682	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	3-Ome
683	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome

684	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
685	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
686	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OH	3-Ome
687	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OBu	3-Ome
688	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-Ooc	3-Ome
689	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
690	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Ome
691	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-Ph	3-Ome
692	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-Ph	3-Ome
693	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-Ph	3-Ome
694	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OPh	3-Ome
695	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-OPh	3-Ome
696	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-OPh	3-Ome
697	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
698	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
699	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
700	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-OH	3-Ome
701	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-OBu	3-Ome
702	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-Ooc	3-Ome
703	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
704	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Ome
705	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-Ph	3-Ome
706	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	5-Ph	3-Ome
707	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	6-Ph	3-Ome
708	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4-OPh	3-Ome
709	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	5-OPh	3-Ome
710	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	6-OPh	3-Ome
711	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
712	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
713	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
714	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-OH	3-Ome
715	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-OBu	3-Ome
716	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-Ooc	3-Ome
717	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
718	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Ome
719	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-Ph	3-Ome
720	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	5-Ph	3-Ome
721	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	6-Ph	3-Ome
722	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4-OPh	3-Ome
723	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	5-OPh	3-Ome
724	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	6-OPh	3-Ome
725	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
726	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
727	CH ₂ CH ₂ (4-0Dec-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-Ome
728	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-OH	3-Ome
729	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-OBu	3-Ome
730	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-Ooc	3-Ome
731	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-Ome
732	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Ome
733	CH ₂ CH ₂ (4-0Lau-2-Pyr)	4-Ph	3-Ome

734	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
735	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
736	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
737	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
738	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
739	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
740	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
741	CH_2CH_2 (4-OLau-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
742	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
743	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
744	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
745	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
746	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
747	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
748	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OCe	3-OMe
749	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
750	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
751	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
752	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
753	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
754	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
755	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
756	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
757	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
758	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
759	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	3-OMe
760	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
761	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
762	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
763	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	3-OMe
764	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Cl-Ph)	3-OMe
765	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
766	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
767	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
768	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
769	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
770	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-F-Ph)	3-OMe
771	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
772	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
773	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
774	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-F-Ph)	3-OMe
775	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
776	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
777	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
778	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
779	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
780	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
781	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
782	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
783	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OCe	3-OMe

784	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
785	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
786	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
787	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
788	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
789	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
790	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
791	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
792	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
793	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
794	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
795	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
796	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
797	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
798	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
799	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
800	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
801	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
802	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
803	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
804	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
805	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
806	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
807	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
808	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
809	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
810	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
811	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
812	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
813	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
814	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
815	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
816	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
817	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
818	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
819	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
820	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
821	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
822	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
823	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
824	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
825	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
826	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
827	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
828	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
829	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
830	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
831	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
832	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
833	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe

834	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	3-OMe
835	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	3-OMe
836	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
837	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
838	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
839	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - (4-Me-Ph)	3-OMe
840	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - (4-OMe-Ph)	3-OMe
841	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	6- <i>O</i> - (4-Me-Ph)	3-OMe
842	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	6- <i>O</i> - (4-OMe-Ph)	3-OMe
843	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
844	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
845	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Dec-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
846	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
847	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
848	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
849	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
850	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
851	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
852	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
853	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> -CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
854	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
855	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> -CH ₂ C≡CH	3-OMe
856	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
857	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
858	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
859	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	3-OMe
860	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	3-OMe
861	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	3-OMe
862	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	3-OMe
863	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
864	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
865	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
866	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - (4-Me-Ph)	3-OMe
867	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - (4-OMe-Ph)	3-OMe
868	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6- <i>O</i> - (4-Me-Ph)	3-OMe
869	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6- <i>O</i> - (4-OMe-Ph)	3-OMe
870	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
871	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
872	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
873	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
874	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
875	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
876	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> -CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
877	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> -CH ₂ C≡CH	3-OMe
878	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
879	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
880	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
881	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
882	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
883	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Myr-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe

884	CH_2CH_2 (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
885	CH_2CH_2 (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
886	CH_2CH_2 (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
887	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
888	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
889	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
890	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
891	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
892	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
893	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
894	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
895	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
896	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
897	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
898	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
899	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
900	CH_2CH_2 (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
901	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
902	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
903	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
904	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
905	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
906	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
907	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
908	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
909	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
910	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
911	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
912	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
913	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
914	CH_2CH_2 (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
915	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
916	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
917	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
918	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
919	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
920	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
921	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
922	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
923	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
924	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
925	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
926	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
927	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
928	CH_2CH_2 (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
929	CH_2 (3-Pyr)	4-OH	3-OMe
930	CH_2 (3-Pyr)	4-OBu	3-OMe
931	CH_2 (3-Pyr)	4-OOc	3-OMe
932	CH_2 (3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
933	CH_2 (3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe

934	CH ₂ (3-Pyr)	4-Ph	3-OMe
935	CH ₂ (3-Pyr)	5-Ph	3-OMe
936	CH ₂ (3-Pyr)	6-Ph	3-OMe
937	CH ₂ (3-Pyr)	4-OPh	3-OMe
938	CH ₂ (3-Pyr)	5-OPh	3-OMe
939	CH ₂ (3-Pyr)	6-OPh	3-OMe
940	CH ₂ (3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
941	CH ₂ (3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
942	CH ₂ (3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
943	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OH	3-OMe
944	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OBu	3-OMe
945	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OCc	3-OMe
946	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
947	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
948	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-Ph	3-OMe
949	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-Ph	3-OMe
950	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-Ph	3-OMe
951	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OPh	3-OMe
952	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-OPh	3-OMe
953	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-OPh	3-OMe
954	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
955	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
956	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
957	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OH	3-OMe
958	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OBu	3-OMe
959	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OCc	3-OMe
960	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
961	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
962	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-Ph	3-OMe
963	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-Ph	3-OMe
964	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-Ph	3-OMe
965	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OPh	3-OMe
966	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-OPh	3-OMe
967	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-OPh	3-OMe
968	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
969	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
970	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
971	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OH	3-OMe
972	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OBu	3-OMe
973	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OCc	3-OMe
974	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
975	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
976	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-Ph	3-OMe
977	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-Ph	3-OMe
978	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-Ph	3-OMe
979	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OPh	3-OMe
980	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-OPh	3-OMe
981	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-OPh	3-OMe
982	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
983	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe

984	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
985	CH ₂ (3-Pip)	4-OH	3-OMe
986	CH ₂ (3-Pip)	4-OBu	3-OMe
987	CH ₂ (3-Pip)	4-OCc	3-OMe
988	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
989	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
990	CH ₂ (3-Pip)	4-Ph	3-OMe
991	CH ₂ (3-Pip)	5-Ph	3-OMe
992	CH ₂ (3-Pip)	6-Ph	3-OMe
993	CH ₂ (3-Pip)	4-OPh	3-OMe
994	CH ₂ (3-Pip)	5-OPh	3-OMe
995	CH ₂ (3-Pip)	6-OPh	3-OMe
996	CH ₂ (3-Pip)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
997	CH ₂ (3-Pip)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
998	CH ₂ (3-Pip)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
999	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OH	3-OMe
1000	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OBu	3-OMe
1001	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OCc	3-OMe
1002	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
1003	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
1004	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-Ph	3-OMe
1005	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-Ph	3-OMe
1006	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-Ph	3-OMe
1007	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OPh	3-OMe
1008	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-OPh	3-OMe
1009	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-OPh	3-OMe
1010	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
1011	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
1012	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
1013	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	4-F
1014	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1015	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	4-F
1016	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	4-F
1017	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	4-F
1018	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	4-F
1019	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1020	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1021	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1022	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OBu	4-F
1023	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1024	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	4-F
1025	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-Ph	4-F
1026	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	4-F
1027	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-OPh	4-F
1028	CH ₂ CH ₂ NHMe	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1029	CH ₂ CH ₂ NHMe	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1030	CH ₂ CH ₂ NHMe	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1031	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	4-F
1032	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1033	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-F

1034	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	4-F
1035	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	4-F
1036	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OPh	4-F
1037	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1038	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1039	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1040	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OBu	4-F
1041	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1042	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	4-F
1043	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	4-F
1044	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	4-F
1045	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-OPh	4-F
1046	CH_2CH_2 (2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1047	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1048	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1049	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1050	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1051	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1052	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1053	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1054	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1055	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1056	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1057	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1058	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1059	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1060	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1061	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1062	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1063	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1064	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1065	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1066	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1067	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1068	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1069	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1070	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1071	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1072	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1073	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1074	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1075	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1076	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1077	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1078	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1079	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1080	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1081	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1082	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1083	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F

1084	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> dc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1085	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> Bu	4-F
1086	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-F
1087	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1088	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1089	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> Ph	4-F
1090	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	6- <i>O</i> Ph	4-F
1091	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1092	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1093	CH_2CH_2 (4- <i>O</i> Lau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1094	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4- <i>O</i> Bu	3- <i>O</i> Me, 4-F
1095	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3- <i>O</i> Me, 4-F
1096	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1097	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1098	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1099	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	5- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1100	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1101	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1102	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1103	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1104	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- <i>O</i> Bu	3- <i>O</i> Me, 4-F
1105	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3- <i>O</i> Me, 4-F
1106	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1107	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1108	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1109	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	6- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1110	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1111	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1112	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHMe}$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1113	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- <i>O</i> Bu	3- <i>O</i> Me, 4-F
1114	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3- <i>O</i> Me, 4-F
1115	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1116	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1117	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1118	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1119	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1120	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1121	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1122	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- <i>O</i> Bu	3- <i>O</i> Me, 4-F
1123	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3- <i>O</i> Me, 4-F
1124	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1126	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1127	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6- <i>O</i> Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1128	CH_2CH_2 (2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1129	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1130	CH_2CH_2 (2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3- <i>O</i> Me, 4-F
1131	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> Bu	3- <i>O</i> Me, 4-F
1132	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4- <i>O</i> - $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3- <i>O</i> Me, 4-F
1133	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F
1134	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3- <i>O</i> Me, 4-F

1135	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1136	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1137	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1138	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1139	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1140	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1141	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe, 4-F
1142	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1143	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1144	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1145	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1146	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1147	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1148	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1149	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1150	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe, 4-F
1151	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1152	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1153	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1154	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1155	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1156	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1157	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1158	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1159	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe, 4-F
1160	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1161	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1162	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1163	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1164	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1165	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1166	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1167	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-Bu	3-OMe, 4-F
1168	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	3-OMe, 4-F
1169	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1170	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1171	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1172	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1173	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1174	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1175	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1176	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-OBu	2-F
1177	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-Ph	2-F
1178	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-Ph	2-F
1179	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-OPh	2-F
1180	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OBu	2-F
1181	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	2-F
1182	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	2-F
1183	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	2-F
1184	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2-F

1185	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1186	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1187	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OBu	2-F
1188	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	2-F
1189	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	2-F
1190	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	2-F
1191	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1192	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1193	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1194	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1195	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1196	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1197	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1198	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1199	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C \equiv CH	2-F
1200	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1201	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1202	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1203	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1204	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1205	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1206	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1207	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1208	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1209	CH_2CH_2 (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1210	CH_2CH_2 (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1211	CH_2CH_2 (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1212	CH_2CH_2 (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1 2 1 3	CH_2CH_2 (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1214	CH_2CH_2 (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1215	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1216	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C \equiv CH	2-F
1217	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1218	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1219	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1220	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1221	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1222	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1223	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1224	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-OBu	3-F
1225	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-Ph	3-F
1226	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-Ph	3-F
1227	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-OPh	3-F
1228	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-F
1229	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OBu	3-F
1230	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-F
1231	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	3-F
1232	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-F
1233	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-F
1234	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-F

1235	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	3-F
1236	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-F
1237	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-F
1238	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-F
1239	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1240	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1241	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1242	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1243	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1244	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1245	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1246	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1247	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-F
1248	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1249	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1250	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1251	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-F
1252	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1253	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1254	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1255	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1256	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1257	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1258	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1259	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1260	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1261	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1262	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1263	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1264	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-F
1265	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1266	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1267	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1268	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-F
1269	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1270	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1271	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1272	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	2-OMe
1273	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	2-OMe
1274	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	2-OMe
1275	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	2-OMe
1276	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1277	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	2-OMe
1278	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	2-OMe
1279	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	2-OMe
1280	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	2-OMe
1281	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1282	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1283	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1284	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-OMe

1285	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1286	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1287	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1288	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1289	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1290	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1291	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1292	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1293	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1294	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1295	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-OMe
1296	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1297	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1298	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1299	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-OMe
1300	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1301	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1302	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1303	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1304	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1305	CH ₂ CH ₂ (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1306	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1307	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1308	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1309	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1310	CH ₂ CH ₂ (4-ODEC-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1311	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1312	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-OMe
1313	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1314	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1315	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1316	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-OMe
1317	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1318	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1319	CH ₂ CH ₂ (4-OLAU-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1320	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	4-OMe
1321	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	4-OMe
1322	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	4-OMe
1323	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	4-OMe
1324	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1325	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	4-OMe
1326	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-OMe
1327	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-OMe
1328	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-OMe
1329	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1330	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1331	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1332	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1333	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1334	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-OMe

1335	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1336	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Ome
1337	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Ome
1338	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Ome
1339	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Ome
1340	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1341	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1342	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Ome
1343	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Ome
1344	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Ome
1345	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Ome
1346	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Ome
1347	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Ome
1348	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1349	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Ome
1350	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Ome
1351	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Ome
1352	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Ome
1353	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1354	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Ome
1355	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Ome
1356	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Ome
1357	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Ome
1358	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1359	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Ome
1360	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Ome
1361	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Ome
1362	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Ome
1363	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Ome
1364	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Ome
1365	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1366	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1367	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1368	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1369	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1370	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1371	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1372	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1373	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1374	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1375	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1376	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1377	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1378	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1379	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1380	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1381	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-Me
1382	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1383	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1384	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me

1385	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Me
1386	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1387	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1388	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1389	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1390	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1391	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1392	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1393	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1394	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1395	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1396	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1397	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-Me
1398	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Me
1399	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1400	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1401	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1402	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1403	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-Me
1404	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-Me
1405	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-Me
1406	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1407	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1408	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1409	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1410	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1411	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1412	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1413	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1414	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1415	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1416	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1417	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1418	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1419	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1420	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1421	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1422	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1423	CH ₂ CH ₂ (4-ODEc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1424	CH ₂ CH ₂ (4-ODEc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1425	CH ₂ CH ₂ (4-ODEc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1426	CH ₂ CH ₂ (4-ODEc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1427	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Me
1428	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Me
1429	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1430	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1431	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1432	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Me
1433	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1434	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me

1435	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1436	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1437	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1438	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1439	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Cl
1440	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1441	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1442	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1443	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Cl
1444	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1445	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1446	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1447	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Cl
1448	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Cl
1449	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-Cl
1450	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1451	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1452	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1453	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Cl
1454	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1455	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1456	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Cl
1457	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1458	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1459	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1460	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Cl
1461	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1462	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1463	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1464	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Cl
1465	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-Cl
1466	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Cl
1467	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1468	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1469	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1470	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Cl
1471	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-Cl
1472	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-Cl
1473	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-Cl
1474	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1475	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1476	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1477	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1478	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1479	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1480	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1481	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1482	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1483	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1484	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl

1485	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1486	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1487	CH_2CH_2 (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1488	CH_2CH_2 (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1489	CH_2CH_2 (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1490	CH_2CH_2 (4-OCOC-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1491	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1492	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1493	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1494	CH_2CH_2 (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1495	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Cl
1496	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-Cl
1497	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1498	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1499	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1500	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Cl
1501	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1502	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1503	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-Cl
1504	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	4-Br
1505	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1506	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1507	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1508	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1509	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1510	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1511	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Br
1512	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1513	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1514	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1515	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Br
1516	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	4-Br
1517	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1518	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1519	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1520	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Br
1521	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Br
1522	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	2, 4-diF
1523	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1524	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1525	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1526	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1527	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1528	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1529	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2, 4-diF
1530	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1531	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1532	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1533	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2, 4-diF
1534	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	2, 4-diF

1535	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1536	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1537	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1538	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2, 4-diF
1439	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2, 4-diF
1540	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3, 4-diF
1541	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1542	CH_2CH_2 (2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1543	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1544	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1545	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1546	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1547	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3, 4-diF
1548	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1549	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1550	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1551	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3, 4-diF
1552	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3, 4-diF
1553	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1554	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1555	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1556	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3, 4-diF
1557	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3, 4-diF
1558	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3, 4-diOMe
1559	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1561	CH_2CH_2 (2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1562	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1563	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1564	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1565	CH_2CH_2 (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3, 4-diOMe
1566	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1567	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1568	CH_2CH_2 (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1569	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3, 4-diOMe
1570	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3, 4-diOMe
1571	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1572	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1573	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1574	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3, 4-diOMe
1575	CH_2CH_2 (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3, 4-diOMe
1576	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-OC	H
1577	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-Ohp	H
1578	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-CH ₂ CH=CH	H
1579	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-O-CH ₂ C≡CH	H
1580	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-Ph	H
1581	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	5-Ph	H
1582	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	6-OPh	H
1583	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4-(4-Cl-Ph)	H
1584	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1585	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-Hp	H

1586	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	$4\text{-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
1587	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-OHp	H
1588	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-Ph	H
1589	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-(4-F-Ph)	H
1590	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-(4-OMe-Ph)	H
1591	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}$	4-OPh	H
1592	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Oc	H
1593	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-CF_3	H
1594	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OH	H
1595	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OBu	H
1596	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OHp	H
1597	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ooc	H
1598	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OCF_3	H
1599	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$4\text{-CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
1600	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$4\text{-O-CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H
1601	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$4\text{-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
1602	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$4\text{-O-CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H
1603	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	H
1604	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-Ph	H
1605	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-Ph	H
1606	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Me-Ph)	H
1607	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-OMe-Ph)	H
1608	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-F-Ph)	H
1609	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	H
1610	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-Me-Ph)	H
1611	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-OMe-Ph)	H
1612	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-F-Ph)	H
1613	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-(4-Cl-Ph)	H
1614	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	H
1615	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-OPh	H
1616	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-OPh	H
1617	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Me-Ph)	H
1618	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-OMe-Ph)	H
1 6 1 9	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-F-Ph)	H
1620	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-O-(4-Cl-Ph)	H
1621	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Me-Ph)	H
1622	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-OMe-Ph)	H
1623	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-F-Ph)	H
1624	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	6-O-(4-Cl-Ph)	H
1625	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$3, 4\text{-(CH=CH-CH=CH)-}$	H
1626	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$4, 5\text{-(CH=CH-CH=CH)-}$	H
1627	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	$5, 6\text{-(CH=CH-CH=CH)-}$	H
1628	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Oc	3-OMe
1629	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Hp	3-OMe
1630	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ooc	3-OMe
1631	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-OMe
1632	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	5-Ph	3-OMe
1633	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
1634	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-F-Ph)	3-OMe
1635	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-OMe

1636	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Ome
1637	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Hp	3-F
1638	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-Cl
1639	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	4-F
1640	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Ome-Ph)	3, 5-di-Ome
1641	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	2, 5-di-Cl
1642	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	3-Ome
1643	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-F-Ph)	3-Me
1644	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-CN
1645	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-Ome, 4-F
1646	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OH	H
1647	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ooc	H
1648	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1649	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	H
1650	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-Ph	H
1651	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-Ph	H
1652	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-Cl-Ph)	H
1653	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-F-Ph)	H
1654	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-Me-Ph)	H
1655	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-Ome-Ph)	H
1656	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OPh	H
1657	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-OPh	H
1658	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-Ome
1659	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Br
1660	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	4-F
1661	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-F-Ph)	2, 4-di-Cl
1662	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Oc	3-Br
1663	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-OPh	H
1664	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-Ph	2, 5-di-Cl
1665	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-Oc	3-Ome
1666	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-OPh	3-F
1667	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-(4-Br-Ph)	H
1668	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Ome
1669	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-O-(4-F-Ph)	3, 4-di-Ome
1670	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-(4-F-Ph)	3, 4-di-OH
1671	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-OBu	H
1672	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-Ph	H
1673	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	5-Ph	H
1674	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-Br
1675	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-Me
1676	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-OPh	4-Cl
1677	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	6-Me	2, 4-di-Me
1678	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-Oc	3-Br
1679	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OBu	H
1680	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Oc	H
1681	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1682	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CH ₂ C≡CH	H
1683	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Ph	H
1684	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	5-Ph	H
1685	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Hp	H

1686	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OPh	H
1687	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	6-OPh	H
1688	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
1689	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1690	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
1691	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CF ₃	H
1692	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OCc	3-OMe
1693	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-O-CH ₂ CH-CH ₂	4-F
1694	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CH ₂ CH-CH ₂	2, 4-di-Cl
1695	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Ph	3, 4, 5-tri-Cl
1696	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Ph	2, 6-di-Cl
1697	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	5-Ph	2-OMe
1698	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OPh	4-Br
1699	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OPh	3-Cl
1700	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2, 4, 6-tri-OMe
1701	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Me
1702	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-OMe
1703	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OC	H
1704	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-CF ₃	H
1706	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OBu	H
1707	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OPh	H
1708	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OCc	H
1709	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OCF ₃	H
1710	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1711	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
1712	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-CH ₂ C≡CH	H
1713	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-CH ₂ C≡CH	H
1714	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-Ph	H
1715	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	5-Ph	H
1716	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-Ph	H
1717	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-(4-Me-Ph)	H
1718	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-(4-OMe-Ph)	H
1719	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-(4-F-Ph)	H
1720	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-(4-Cl-Ph)	H
1721	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-(4-Me-Ph)	H
1722	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-(4-OMe-Ph)	H
1723	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-(4-F-Ph)	H
1724	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-(4-Cl-Ph)	H
1725	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-OPh	H
1726	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	5-OPh	H
1727	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-OPh	H
1728	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-(4-Me-Ph)	H
1729	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-(4-OMe-Ph)	H
1730	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-(4-F-Ph)	H
1731	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	4-O-(4-Cl-Ph)	H
1732	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-O-(4-Me-Ph)	H
1733	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-O-(4-OMe-Ph)	H
1734	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-O-(4-F-Ph)	H
1735	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	6-O-(4-Cl-Ph)	H
1736	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}r^t$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H

1737	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1738	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
1739	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Oc	3-OMe
1740	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Hp	3-OMe
1741	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-00c	3-OMe
1742	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Ph	3-OMe
1743	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	5-Ph	3-OMe
1744	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
1745	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-(4-F-Ph)	3-OMe
1746	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-OPh	3-OMe
1747	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1748	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Oc	4-OMe
1749	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Hp	3-F
1750	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Ph	3-Cl
1751	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Ph	4-F
1752	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-(4-OMe-Ph)	3, 5-di-OMe
1753	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-(4-Cl-Ph)	2, 5-di-Cl
1754	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-(4-F-Ph)	3-Me
1755	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-OPh	3-CN
1756	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHP}^t$	4-Ph	3-OMe, 4-F

上記表中、略号は以下の意味を示す。

【0042】

Ac: アセチル基

Bu: ブチル基

Bu^t: t-ブチル基

Dec: デカノイル基

Et: エチル基

Hp: ヘプチル基

Lau: ラウロイル基

Me: メチル基

Myr: ミリストイル基

Oc: オクチル基

Pal: パルミトイル基

Ph: フェニル基

Pip: ピペリジニル基

Pt^t: イソプロピル基

Pyr: ピロリジニル基

Suc: スクシニル基。

【0043】これらの化合物のうち、好適には、化合物番号44、65、70、71、97、118、126、143、151、153、155、156、158、159、160、161、185、246、248、251、252、253、254、283、305、323、350、400、414、470、498、550、559、571、576、577、603、661、665、666、667、754、760、811、829、856、906、920、1004、1033、1051、1115、1133、1326、1337、1389、1603、1606、1607、16

08、1609、1631、1640、1645、1649、1683及び1714の化合物を挙げることができ、更に好適には、化合物番号65、71、97、143、155、158、159、160、161、246、248、251、252、253、254、283、350、414、498、571、661、665、666、667、754、1004、1051、1133、1603、1606、1607、1608、1609、1631、1640、1645、1649及び1683の化合物を挙げることができ、更に好適には、化合物番号155、158、159、160、161、248、253、254、283、498、661、665、666、667、754、1051、1133、1603、1607、1608、1609、1631、1640、1645及び1683の化合物を挙げることができ、特に好適には、化合物番号155: 1-メチル-2-[2-(4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]ピロリジン、化合物番号160: 2-[2-(4-(4-フルオロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、化合物番号161: 2-[2-(4-(4-クロロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]-1-メチルピロリジン、化合物番号661: 2-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]エチル-1-メチルピロリジン、化合物番号1051: 2-[2-[2-(4-フ

ルオロフェニル) エチル] -4-フェニル] フェノキシ] エチル-1-メチルピロリジン、
 化合物番号1133: 2-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル) エチル] -4-フェニル] フェノキシ] エチル-1-メチルピロリジン、
 化合物番号1603: N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1631: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(3-メトキシフェニル) エチル-4-フェニル] フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1640: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロフェニル) エチル-4-フェニル]

ル] フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1645: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル) エチル-4-フェニル] フェノキシ] プロピルアミン及び
 化合物番号1683: N, N-ジメチル-4-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン

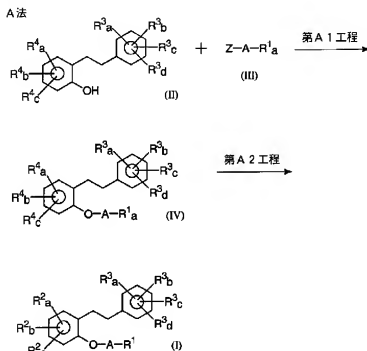
の化合物を挙げることができる。

【0044】

【発明の実施の形態】本発明の一般式(1)を有する化合物は、以下の方法に従って容易に製造される。

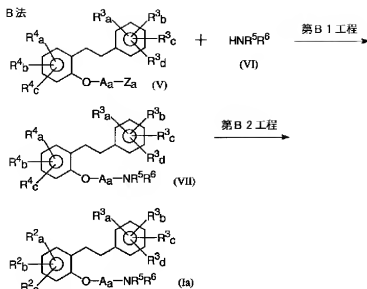
【0045】

【化4】



【0046】

【化5】



【0047】上記式中、 R^1 、 R^2a 、 R^2b 、 R^2c 、 R^3a 、 R^3b 、 R^3c 、 R^3d 及びAは、前述したものと同意義を示し、 R^1a は、保護されたアミノ基、保護されたモノ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基又は置換されてもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、保護されたヒドロキシ基、 C_1-C_{20} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_1-C_{20} アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ若しくはジ- C_1-C_6 アルキルカルバモイルオキシ基であり、また環の窒素原子が保護されている。）を示し、 R^4a 、 R^4b 及び R^4c は、ヒドロキシが保護されている他、それぞれ、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c と同意義を示し、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し、Aaは、 C_1-C_6 アルキレン基を示し、Zは、ヒドロキシ基、ハロゲン原子（好適には、塩素、臭素又は碘素原子）、 C_1-C_6 アルカンスルホニルオキシ基（好適には、メタンスルホニルオキシ又はエタンスルホニルオキシ基）又は C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリールスルホニルオキシ基（好適には、ベンゼンスルホニルオキシ又は p -トルエンスルホニルオキシ基）を示し、Zaは、ハロゲン原子（好適には、塩素、臭素または碘素原子）を示す。

【0048】 R^1a 、 R^4a 、 R^4b 、 R^4c 等のヒドロキシ基の保護基は、例えば、テトラヒドロフランニル、テトラヒドロピラニル基のような環状エーテル基、メトキシメチル基、メトキシメチルメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチルメチルオキシカルボニル基であり得、好適には、テトラヒドロピラニル、メトキシメチル、ベンジル、 p -メトキシベンジル、 p -

ブロムベンジル、ベンジロキシカルボニル、 p -メトキシベンジロキシカルボニル、 p -ブロムベンジロキシカルボニル基である。

【0049】 R^1a のヘテロシクリル環の窒素原子、アミノ基、モノ- C_1-C_6 アルキルアミノ基等の保護基は、例えば、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルカノイル基、 C_6-C_{10} アリールメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチルオキシカルボニル基であり得、好適には、 t -ブトキシカルボニル、アセチル、ベンジル、 p -メトキシベンジル、 p -ブロムベンジル、ベンジロキシカルボニル、 p -メトキシベンジロキシカルボニル、 p -ブロムベンジロキシカルボニル基である。

【0050】A法は、化合物（I）製造する方法である。

【0051】第A1工程は、一般式（IV）を有する化合物を製造する工程で、一般式（II）を有する化合物と一般式（III）を有する化合物を反応させることにより達成される。

【0052】Zがハロゲン原子、 C_1-C_6 アルカンスルホニルオキシ基又は C_6-C_{10} アリールスルホニルオキシ基を示す場合、本反応は、不活性溶剤中、塩基の存在下に行われる。

【0053】使用される塩基は、好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩、弗化ナトリウム、弗化カリウムのようなアルカリ金属弗化塩、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド、リチウムメトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、ピリジン、ピコリン、トリエチルアミン、 N -メチルモルホリン、4-ジメチルアミノピリジンのよ

うな有機アミンであり得、さらに好適には、アルカリ金属炭酸塩、アルカリ金属炭化塩、アルカリ金属水素化合物又はアルカリ金属アルコキシドである。

【0054】使用される不活性溶剤は、反応に関与しなければ、特に制限されず、例えば、ヘキサン、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、アセトニトリルのようなニトリル類、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類又はこれらの混合溶剤であり得、好適には、エーテル類、ケトン類、アミド類又はスルホキシド類である。

【0055】反応温度は、原料化合物 (II) および (II I)、溶剤並びに塩基の種類により異なるが、通常0℃乃至100℃ (好適には、10℃乃至80℃) であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至48時間 (好適には1乃至24時間) である。

【0056】Zがヒドロキシ基を示す場合、本反応は、不活性溶剤中、トリフェニルホスフィン及びアゾジカルボン酸メチル、アゾジカルボン酸エチルのようなアゾジカルボン酸C₁ - C₄ アルキルエステルの存在下に行われる。

【0057】使用される不活性溶剤は、上記と同様なものをあげることができるが、好適には、芳香族炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類又はエーテル類である。

【0058】反応温度は、原料化合物 (II) および (II I)、溶剤並びに塩基の種類により異なるが、通常-20℃乃至100℃ (好適には、10℃乃至80℃) であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至48時間 (好適には1乃至24時間) である。

【0059】反応終了後、本反応の目的化合物 (IV) は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、不溶物が存在する場合は、適宜濾去して、溶剤を減圧留去することによって又は溶剤を減圧留去した後、残留物に水を加え、酢酸エチルのような水不混和性有機溶媒で抽出し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することにより得ることができ、必要ならば、常法、例えば、再結晶、カラムクロマトグラフィー等によって精製することができる。

【0060】第A2工程は、所望により行う工程であり、

反応 (a) : R¹a、R⁴a、R⁴b及び/又はR⁴cに含まれるヒドロキシの保護基を除去する反応、

反応 (b) : 反応 (a) により生成したヒドロキシ基をアルキル化 (アルケニル化、アルキニル化等を含む。)、アシル化又はカルバモイル化する反応

反応 (c) : R¹aに含まれる窒素原子、アミノ基等の保護基を除去する反応

反応 (d) : R¹aに含まれるアルコシカルボニル基をメチル基に又はアルカニル基をアルキル基に変換する反応及び

反応 (e) : R¹aに含まれる=NH基をアルキル化する反応を含み、適宜順序変えて行われる。

【0061】反応 (a) : 反応 (a) におけるR¹a、R⁴a、R⁴b及び/又はR⁴cに含まれるヒドロキシの保護基を除去する反応は、保護基を除去する反応は、保護基の種類により異なり、有機合成化学でよく知られている方法で行われる。

【0062】ヒドロキシ基の保護基がアリールメチル基またはアリールメチルオキシカルボニル基である場合には、不活性溶剤 (好適には、メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチルのようなエステル類、酢酸のような脂肪族酸又はこれらの有機溶剤と水との混合溶剤) 中、接触還元触媒 (好適には、パラジウム-炭素、ラネウニウム、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム、パラジウム-硫酸バリウム等) の存在下、相当する化合物を水素 (通常1乃至10気圧) 好適には、1乃至3気圧) と反応することにより行われる。

【0063】反応温度は、通常0℃乃至100℃ (好適には、20℃乃至80℃) であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至48時間 (好適には1乃至24時間) である。

【0064】ヒドロキシ基の保護基がメトキシメチル基、メトキシトキシメチル基又は環状エーテル基である場合には、例えば、不活性溶剤 (ヘキサン、ベンゼンのような炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類、酢酸エチルのようなエステル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類又はこれらの有機溶剤と水との混合溶剤であり、好適には、エステル類、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類である。) 中、相当する化合物を酸 (例えば、塩化水素、硝酸、塩酸、硫酸のような無機酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のような有機酸、三弗化ホウ素のようなルイス酸、ダウエクス50W (登録商標) のような強酸性の關イオン交換樹脂等であり、好適には、無機酸及び有機酸であり、更に好適には、塩酸、硝酸、トリフルオロ酢酸である。) と反応することにより行われる。

【0065】反応温度は、通常-10℃乃至100℃(好適には、-50℃乃至50℃)であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常5分乃至48時間(好適には30分乃至10時間)である。

【0066】また、ヒドロキシ基の保護基の種類を変え、反応条件を選択することによって、R¹a、R⁴a、R⁵b及び/又はR⁶cに含まれるヒドロキシの保護基を選択的に除去することができる。

【0067】反応終了後、本反応の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0068】反応(b)：反応(b)におけるヒドロキシ基をアルキル化(アルケニル化、アルキニル化等を含む。)、アシル化又はカルバシル化する反応は、有機合成化学で周知の方法により行われる。例えば、不活性溶剤(好適には、ベンゼン、トルエンのような芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素、酢酸エチルのようなエステル類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、N、N-ジメチルアセトアミドのようなニミド類)中、塩基存在又は不存在下(塩基は、好適には、トリエチルアミン、ピリジン、ジエチルイソプロピルアミン、4-ジメチルアミノピリジンのような有機三級アミン類)、アルキル化剤(アルケニル化剤、アルキニル化剤等を含む。)、アシル化剤又はカルバシル化剤を反応させることにより行われる。

【0069】使用されるアルキル化剤(アルケニル化剤、アルキニル化剤等を含む。)、アシル化剤又はカルバシル化剤としては、臭化若しくは沃化ブチル、臭化ヘプタール、ヨウ化ヘプタール、臭化オクチル、ヨウ化オクチル、ヨウ化ノニル、ヨウ化デシルのようなC₇-C₁₀アルキルハライド、臭化アリル、ヨウ化アリル、ヨウ化メタアリル、ヨウ化(2-ブチニル)、ヨウ化(2-ペンチニル)、ヨウ化(2-ヘキセニル)のようなC₃-C₆アルケニルハライド、臭化プロパルギル、ヨウ化プロパルギル、ヨウ化(2-ブチニル)、ヨウ化(2-ペンチニル)、ヨウ化(2-ヘキセニル)のようなC₃-C₆アルキニルハライド、クロロ炭酸メチル、プロモ炭酸メチル、クロロ炭酸エチル、クロロ炭酸プロピル、クロロ炭酸イソプロピル、クロロ炭酸ブチル、クロロ炭酸t-ブチル、クロロ炭酸ベンチル、クロロ炭酸ヘキシル、クロロ炭酸ヘプタール、クロロ炭酸オクチル、クロロ炭酸ニル、クロロ炭酸デシル、クロロ炭酸ウンデシル、クロロ炭酸ドデシル、クロロ炭酸トリデシル、クロ

ロ炭酸テトラデシルのようなハロゲン炭酸C₁-C₁₄アルキル、クロロ炭酸フェニル、クロロ炭酸トリル、クロロ炭酸フルオロフェニル、クロロ炭酸クロロフェニル、クロロ炭酸メトキシフェニル、クロロ炭酸ナフチルのようなハロゲン炭酸C₆-C₁₆アリール、アセチルクロライド、プロピオンクロライド、ブチルクロライド、ペンチルクロライド、イソブチルクロライド、パレリルクロライド、ビパロイルクロライド、ヘキサノイルクロライド、3,3-ジメチルブチルクロライド、ヘプタノイルクロライド、オクタノイルクロライド、ノノノイルクロライド、デカノイルクロライド、ラウロイルクロライド、ミリスチルクロライド、パルミチルクロライド、ステアロイルクロライド、エイコサノイルクロライド、ドコサノイルクロライドクロライドのようなC₂-C₂₀アルカノイルハライド、ギ酸と酢酸の混合酸無水物、無水酢酸、無水プロピオン酸、無水ブタン酸、無水吉草酸、無水パルピリン酸、無水ヘキサン酸、無水ヘプタン酸、無水オクタン酸、無水ノナン酸、無水デカン酸、無水ラウリン酸、無水ミリスチン酸、無水パルミチン酸のようなC₂-C₂₀カルボン酸無水物、無水マコニル酸、無水グルタル酸、無水アジピン酸、無水メレニル酸、無水スベリン酸のような環状酸無水物、イソシアン酸、メチルイソシアネート、エチルイソシアネート、プロピルイソシアネート、ブチルイソシアネート、ペンチルイソシアネート、ヘキシルイソシアネートのようなC₁-C₆アルキルイソシアネート、N-ジメチルカルバモイルクロリド、N-ジエチルカルバモイルクロリド、N、N-ジプロピルカルバモイルクロリド、N、N-ジブチルカルバモイルクロリド、N、N-ジペンチルカルバモイルクロリド、N、N-ジヘキシルカルバモイルクロリドのようなジ-C₁-C₆アルキルカルバモイルハライドを挙げることができる。

【0070】また、ヒドロキシ基をアシル化する反応は、相当するヒドロキシ化合物とカルボン酸(例えば、酢酸、プロピオン酸、ブタン酸、草吉酸、ヘキサン酸、3,3-ジメチルブタン酸、ヘプタン酸、オクタン酸、ノナン酸、デカン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、エイコサン酸、ドコサン酸のようなC₂-C₂₀脂肪族カルボン酸又はt-ブチルマロン酸、t-ブチルコヒク酸、t-ブチルグルタル酸、t-ブチルアジピン酸、t-ブチルピリニル酸、t-ブチルスベリン酸のようなジカルボン酸モノアルキル等)を前記第A1工程のZがヒドロキシ基である場合と同様に反応させることによっても行なわれる。また、得られたt-ブチルエステル化合物は、前記本工程の反応(a)と同様に、酸と処理して、目的のカルボキシで置換されたC₂-C₇アルカノイルオキシ化合物に導くことができる。

【0071】反応温度は、通常-10℃乃至50℃(好適には、0℃乃至30℃)であり、反応時間は、反応温

度等により異なるが、通常15分間乃至20時間（好適には、30分間乃至10時間）である。

【0072】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、不溶物が存在する場合は、適宜濾別し、反応液が酸性若しくはアルカリ性の場合は、適宜中和した後、前述した第A1工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行われる。

【0073】反応（c）：反応（c）におけるR^{1a}に含まれる窒素原子、アミノ基等の保護基を除去する反応は、保護基の種類により異なり、有機合成化学でよく知られている方法で行われる。

【0074】窒素原子の保護基がアリールメチル基又はアリールメトキシカルボニル基である場合には、前記第A2工程の反応（a）のヒドロキシの保護基がアリールメチル基である場合の除去反応と同様に行なわれる。

【0075】窒素原子の保護基が1-ブトキシカルボニル基である場合には、前記本工程の反応（a）のヒドロキシの保護基がメトキシメチル基等である場合の除去反応と同様に行なわれる。

【0076】さらに、窒素原子の保護基がアルコキシカルボニル残基である場合には、不活性溶剤（好適には、メタノール、エタノールのようなアルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、水または水と上記有機溶剤との混合溶剤）中、塩基（好適には、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属炭酸化物または炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩）と、反応させ、加水分解によって、相当する保護基が除去される。

【0077】反応温度は、溶媒等により異なるが、通常0℃乃至100℃（好適には、室温乃至60℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至24時間（好適には、1時間乃至16時間）である。

【0078】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、前述したA法の本工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行なわれる。

【0079】反応（d）：反応（d）におけるR^{1a}に含まれるアルコキシカルボニル基をメチル基に又はアルカニル基をアルカニル基に変換する反応は、不活性溶剤（好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類）中、還元剤（好適には、水素化リチウムアルミニウムのようなアルカリ金属水素化アルミニウム）と、反応させることによって行なわれる。

【0080】反応温度は、溶媒等により異なるが、通常0℃乃至100℃（好適には室温乃至80℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至24時間（好適には、1時間乃至16時間）である。

【0081】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、前述した第A1工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行われる。

【0082】反応（e）：反応（e）におけるR^{1a}に含まれる=NH基をアルカル化する反応は、アルカル化剤として、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ヨウ化プロピル、ヨウ化ブチル、ヨウ化ペンチル、ヨウ化ヘキシルのようなC₁—C₆アルキルハライドを、塩基（例えば、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水素化ナトリウムのような水素化アルカリ金属）の存在下に作用させて、前記本工程の反応（b）と同様に行なわれる。

【0083】B法は、化合物（I）において、R¹がアミノ基又はモノー若しくはジ- C₁—C₆アルキルアミノ基である化合物（Ia）を製造する方法である。

【0084】第B1工程は、一般式（VII）を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式（V）を有する化合物と一般式（VI）を有する化合物を反応させることにより達成される。

【0085】使用される不活性溶剤は、反応に関与しなければ、特に制限されず、例えば、ヘキサン、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、ジクロルメタン、クロホルム、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエーテル類のようなケトン類、アセトニトリルのようなニトリル類、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホルムアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類、水又はこれらの混合溶剤であり得、好適には、エーテル類又は含水エーテル類である。

【0086】反応温度は、原料化合物（V）および（VI）及び溶剤の種類により異なるが、通常0℃乃至150℃（好適には、20℃乃至100℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至30時間（好適には1乃至12時間）である。

【0087】反応終了後、本工程の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0088】第B2工程では、化合物（Ia）を製造する工程で、所望により、R^{1a}、R^{2a}及び/又はR^{3a}に含まれるヒドロキシの保護基を除去することにより達成され、本反応は、前記第A2工程の反応（a）と同様に行

われる。

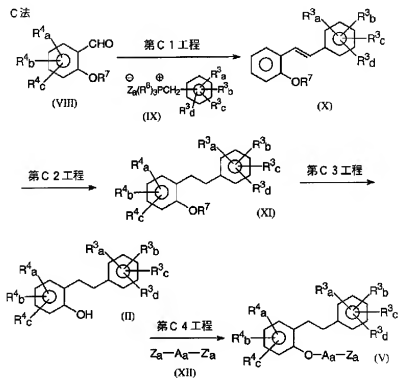
【0089】また、化合物(1)は、常法に従って、酸で処理することによって薬理上許容し得る塩に変換することができる。例えば、不活性溶剤(好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、メチレンクロリド、クロロホルムのヨウナハロゲン炭化水素類)中、相当する酸と室温で5分間乃至1時間反応させ、溶剤を減圧で留去することによって得ることができる。また、酸性の樹脂カラム【例えば、CM-セファデックスC-25(登録商標)等】に化合物(1)又はその酸付加塩を吸着させ、希塩酸を溶出することによって、塩酸塩を得ることができる。

【0090】原料化合物(II)、(V)及び(III)は、公知であるか公知の方法に従って製造される【例えば、特開昭55-20740号公報、特開平2-304022号公報、特開平6-234736号公報、特開平6-306025号公報、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第33巻、第1頁(1990年):J. Med. Chem., 33, 1 (1990)、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第36巻、第3580頁(1993年):J. Med. Chem., 36, 3580 (1993)等】。

又、以下の方法によっても製造される。

【0091】

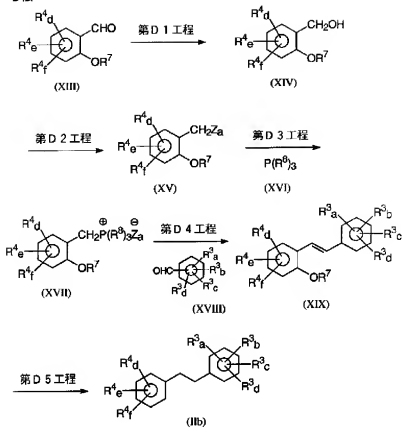
【化6】

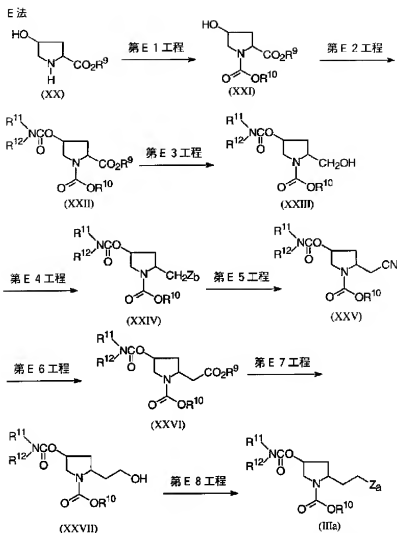


【0092】

【化7】

D 法





【0094】上記式中、 R^3a 、 R^3b 、 R^3c 、 R^3d 、 R^4a 、 R^4b 、 R^4c 、 Aa 及び Za は、前述したものと同意義を示し、 R^4d 及び R^4e は、それらが結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、 R^4e は、それらが結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示さない他、 R^4a と同意義を示し、 R^7 は、水素原子又はヒドロキシ基の保護基を示し、 R^8 は、 $C_6 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^9 は、 $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 R^{10} は、 $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なって、水素原子又は $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 Za は、ハロゲン原子を示し、 Zb は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルカンスルホニルオキシ基又は $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アリールスルホニルオキシ基を示す。

【0095】C 法は、化合物 (II) 及び (V) を製造する方法である。第 C 1 工程は、一般式 (X) を有する化合物を

製造する工程で、不活性溶剤中（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、 N -メチルピロリドン、ヘキサメチルスホルアミドのようなアミド類、好適には、ニトリル類）、塩基（例えば、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセ-7-エン (DBU)、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノナ-5-エン (DBN) のようなアミン類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物、ナトリウムアミド、カリウムアミドのようなアルカリ金属アミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムメトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、ブチリチウム、 s -ブチリチウムのようなアルキル金属化合物、フェニールリチウムのようなアリール金属化合物、好適には、アミン類、アルカリ金属水酸化物、アルカリ金属アルコキシド又はアルキル金属化合物) の存在下、一般式 (VIII) を有する化合物を

と一般式(IX)を有する化合物を、0℃乃至200℃(好適には、20℃乃至150℃)で、30分間乃至24時間(好適には、1乃至10時間)反応させることにより行われる。

【0096】第C2工程は、一般式(XI)を有する化合物を製造する工程で、化合物(X)を接換還元することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)におけるヒドロキシ基の保護基がアリールメチル基等である場合の接換還元による除去反応と同様に行われる。

【0097】第C3工程は、化合物(II)を製造する工程で、化合物(XI)のヒドロキシ基の保護基を除去することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)と同様に行われる。

【0098】第C4工程は、化合物(V)を製造する工程で、化合物(II)と一般式(XII)を有する化合物を反応させることにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)と同様に行われる。又、所望により、前記A法第A2工程反応(a)及び反応(b)と同様に、ヒドロキシ基の保護基の除去及びアルキル化等を行うことができる。

【0099】D法は、化合物(II)において、R^a、R^b等が、それらが結合している炭素原子と共にC₁—C₆アルキル、C₁—C₆アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示す化合物(IIb)を製造する方法である。第D1工程は、一般式(XIV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、好適には、エーテル類)、一般式(XIII)を有する化合物と還元剤(例えば、水素化チウムアルミニウム、水素化アルミニウムのような水素化アルミニウム化合物、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような水素化ホウ素ナトリウム化合物、好適には、水素化アルミニウム化合物)を用い、-10℃乃至100℃(好適には、10℃乃至50℃)で、30分間乃至10時間(好適には、1乃至5時間)反応させることにより行われる。

【0100】第D2工程は、一般式(XV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、好適には、エーテル類)、化合物(XIV)をハロゲン化剤(例えば、塩化チオニル、臭化チオニルのようなハロゲン化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リンのようなオキシハロゲン化リン、三塩化リン、三臭化リン、三沃化リン、五塩化リン、五臭化リンのようなハロゲン化リン、トリフェニル

ルホスフィンジクロリド、トリフェニルホスフィンジプロミド、トリフェニルホスフィンジアイオダイドのようなC₆—C₁₀アリールホスフィンジハライド、トリフェニルホスフィンのようなトリC₆—C₁₀アリールホスフィンと四塩化炭素、四臭化炭素、四沃化炭素のような四ハロゲン化炭素の混合物、トリフェニルホスフィンのようなトリC₆—C₁₀アリールホスフィンとN-クロロコハク酸イミド、N-ブロモコハク酸イミドのようなN-ハロゲンコハク酸イミド類の混合物等、好適には、ハロゲン化チオニル、ハロゲン化リン又はC₆—C₁₀アリールホスフィンジハライド、特に好適には、塩化チオニル、三塩化リン、三臭化リン、トリフェニルホスフィンジクロリド、トリフェニルホスフィンジプロミド又はトリフェニルホスフィンジアイオダイド)と、-10℃乃至100℃(好適には、10℃乃至50℃)で、30分間乃至10時間(好適には、1乃至5時間)反応させることにより行われる。

【0101】第D3工程は、一般式(XVII)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、好適には、芳香族炭化水素類)、化合物(XV)と一般式(XVI)を有する化合物を、0℃乃至200℃(好適には、20℃乃至100℃)で、30分間乃至24時間(好適には、1乃至5時間)反応させることにより行われる。

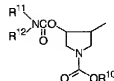
【0102】第D4工程は、一般式(XIX)を有する化合物を製造する工程で、塩基の存在下、化合物(XVII)を一般式(XVIII)を有する化合物と反応させることにより達成され、本工程は、前記C法第C1工程と同様に行われる。

【0103】第D5工程は、化合物(IIb)を製造する工程で、化合物(XIX)を接換還元することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)におけるヒドロキシ基の保護基がアリールメチル基等である場合の接換還元による除去反応と同様に行われる。

【0104】E法は、化合物(III)において、R^{1a}が、式

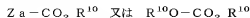
【0105】

【化9】



【0106】(式中、R¹⁰、R¹¹及びR¹²は前述したものと同意義を示す。)を有する基であり、Aがエチレン基であり、Zがハロゲン原子である化合物(IIia)を製造する方法である。第E1工程は、一般式(XXI)を有する

化合物を製造する工程で、塩基の存在下、一般式(XX)を有する化合物を、式



(式中、 R^{10} 及び $Z a$ は前述したものと同意義を示す。)を有する化合物と反応させることにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)におけるアシル化反応と同様に行われる。

【0107】第E2工程は、一般式(XXII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXI)をカルバモイル化することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)におけるカルバモイル反応と同様に行われる。

【0108】第E3工程は、一般式(XXIII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXII)を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記D法第D1工程と同様に行われる。

【0109】第E4工程は、一般式(XXIV)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXIII)をハロゲン化又はスルホニ化することにより達成され、ハロゲン化反応は、前記D法第D2工程と同様に行われる。

【0110】スルホニ化反応は、アシル化剤の代わりに、スルホニ化剤(例えば、メタンスルホニクロライド、メタンスルホニプロピド、エタンスルホニクロライド、ブタンスルホニクロライドのような $C_1 - C_4$ アルカンスルホニハライド、ベンゼンスルホニクロライド、ペンゼンスルホニプロピド、p-トルエンスルホニクロライド、ナフトレンスルホニクロライドのような $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニハライド、メタンスルホン酸無水物、エタンスルホン酸無水物のような $C_1 - C_4$ アルカンスルホン酸無水物、ベンゼンスルホン酸無水物、トルエンスルホン酸無水物のような $C_6 - C_{10}$ アリールスルホン酸無水物等、好適には、メタンスルホニクロライド、ペンゼンスルホニクロライド、p-トルエンスルホニクロライド又はp-トルエンスルホン酸無水物)を用いて、前記A法第A2工程反応(b)のアシル化反応と同様に行われる。

【0111】第E5工程は、一般式(XXV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホアミドのようなアミド類、好適には、アミド類)、化合物(XXIV)をシアノ化合物(例えば、リチウムシアナイド、ナトリウムシアナイド、カリウムシアナイドのようなアルカリ金属シアナイド、好適には、ナトリウムシアナイド)と、0℃乃至200℃(好適には、20℃乃至100℃)で、30分間乃至48時間(好適には、1乃至24時間)反応させることにより行われる。

【0112】第E6工程は、一般式(XXVI)を有する化合物を製造する工程で、酸の存在下(例えば、塩酸、硫酸、硝酸のような鉱酸、酢酸、トリフルオロ酢酸のような脂肪酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ペンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のようなスルホン酸、好適には、化合物(XXIV)を大過剰の $C_1 - C_6$ アルコール(好適には、メタノール又はエタノール)と、0℃乃至200℃(好適には、20℃乃至100℃)で、10分間乃至48時間(好適には、30分間乃至14時間)反応させることにより行われる。

【0113】第E7工程は、一般式(XXVII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXVI)を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記D法第D1工程と同様に行われる。

【0114】第E8工程は、化合物(I11a)を製造する工程で、化合物(XXVII)をハロゲン化することにより達成され、本工程は、前記D法第D2工程と同様に行われる。

【0115】反応終了後、各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合は、適宜濾去して、溶剤を減圧留去することによって又は溶剤を減圧留去した後、残留物に水を加え、酢酸エチルのような水不混和性有機溶媒で抽出し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することにより得ることができ、必要ならば、常法、例えば、再結晶、カラムクロマトグラフィー等とともに精製することができる。化合物(1)は、アドレナリン α_1 拮抗作用をほとんど有さず、セロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレニンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であり、毒性が弱い。 (1)血管内皮細胞や血小板に分布するセロトニン2受容体を遮断し、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)またはこれらの疾患に起因する各種障害、例えば、冠動脈疾患、脳血管障害等の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)として有用であり、(2)コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤または予防剤として有用であり、(3)更にセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤または予防剤(好適には、治療剤)として有用である。

【0116】本発明の化合物(1)およびその薬理上許容される塩類を上記疾患の治療剤または予防剤として使用する場合には、それ自体あるいは適宜の薬理学的に許容される、賦形剤、希釈剤等と混合し、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくはシロップ剤等による経口的又は注射剤等による非経口的に投与することができる。これらの製剤は、賦形剤(例えば、乳糖、白糖、ブドウ糖、マンニト、ソルビトのような糖誘導体；トウモロコシデンプン、馬鈴薯デンプン、 α -デンプン、デキ

ストリン、カルボキシメチルデンプンのようなデンプン誘導体；結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体；アラビアゴム；デキストラン；プルラン；経質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、メタ珪酸アルミン酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体；リン酸カルシウムのようなリン酸塩誘導体；炭酸カルシウムのような炭酸塩誘導体；硫酸カルシウムのような硫酸塩誘導体等）、結合剤（例えば、前記の賦形剤；ゼラチン；ポリビニルピロリドン；マクロゴール等）、崩壊剤（例えば、前記の賦形剤；クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾された、デンプン、セルロース誘導体等）、消泡剤（例えば、タルク；ステアリン酸；ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩；コロイドシリカ；ビーガム、ゲイロウのようなラックス類；癭酸；グリコール；フマル酸、アジピン酸のようなカルボン酸類；安息香酸ナトリウムのようなカルボン酸ナトリウム塩；硫酸ナトリウムのような硫酸類塩；ロイシン；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩；無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類；前記の賦形剤におけるデンプン誘導体等）、安定剤（例えば、メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類；クロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類；塩化ベンザルコニウム；フェノール、クレゾールのようなフェノール類；チメロール；無水酢酸；ソルビン酸等）、増味矯臭剤（例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、香料等）、希釈剤、注射剤用溶剤（例えば、水、エタノール、グリセリン等）等の添加剤を用いて周知の方法で製造される。その使用量は症状、年齢等により異なるが、経口投与の場合には、1回当り1日下限1mg（好適には、10mg）、上限2000mg（好適には、400mg）を、静脈内投与の場合には、1回当り1日下限0.1mg（好適には、1mg）、上限500mg（好適には、300mg）を成人に対して、1日当り1乃至6回症状に応じて投与することが望ましい。以下に、実施例、参考例、試験例及び製剤例を示し、本発明をさらに詳細に説明するが、本発明の範囲は、これらに限定されるものではない。

【0117】

【実施例】

実施例1

1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
(a) 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-

(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール 260mgをN、N-ジメチルアセトアミド5mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムヒポキソド240mgを加えた。これに2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩180mgを加え、室温で1時間撹拌し、さらに50℃で2時間撹拌した。反応液に氷水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：塩化メチレン/メタノール=19/1）で精製して、標記化合物220mg（収率60%）を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.95 (4H, m), 1.95-2.15 (1H, m), 2.15-2.5 (3H, m), 2.42 (3H, s), 2.8~3.05 (4H, m), 3.1-3.25 (1H, m), 3.95-4.2 (2H, m), 6.92 (1H, d, J=8.4Hz), 7.15-7.6 (12H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン220mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.15mlを加え、析出した結晶を取り出し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物195mg（収率80%）を無色結晶として得た。

融点: 153-155℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.9-2.2 (2H, m), 2.15-2.4 (2H, m), 2.4-2.7 (2H, m), 2.76 (3H, s), 2.7-3.1 (5H, m), 3.2-3.4 (1H, m), 3.8-3.95 (1H, m), 3.95-4.1 (1H, m), 4.2-4.35 (1H, m), 6.92 (1H, d, J=8.4Hz), 7.1-7.6 (12H, m)。

【0118】実施例2

(2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

(a) (2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール 290mgをN、N-ジメチルアセトアミド5mlに溶

解し、氷冷撹拌下にカリウム *t*-ブトキシド130 mgを加え、次いで、(2S, 4R)-2-(2-ブromoエチル)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクタノキシカルボニルピロリジン480 mgを加え、室温で1時間撹拌し、さらに50℃で3時間撹拌した。実施例1(a)工程と同様に後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物641 mg(収率99%)を無色油脂状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.75-0.95 (3H, m), 1.1-1.45 (10H, m), 1.45-1.75 (2H, m), 1.8-2.15 (2H, m), 2.2-2.7 (2H, m), 2.7-3.1 (4H, m), 2.77 (3H, s), 2.88 (3H, s), 3.55 (1H, d, J=4.4 および12.6 Hz), 3.55-3.95 (1H, m), 3.95-4.35 (5H, m), 5.1-5.25 (1H, m), 6.90 (1H, d, J=8.2 Hz), 7.1-7.55 (12H, m)。

(b) (2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2-[2-(4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]ピロリジン

水素化アルミニウムリチウム135 mgをテトラヒドロフラン2mlに加え、氷冷撹拌下に前記(a)工程で得た(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクタノキシカルボニル-2-[2-(4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ)エチル]ピロリジン641 mgのテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、同温で1時間撹拌した。反応溶液に硫酸ナトリウム10水和物を少しずつガスの発生がなくなるまで加え、さらに30分撹拌して過剰の水素化合物を分解した。不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製して、320 mg(収率67%)の無色油状物を得た。この内の220 mgにヘキサンを加えて、かき混ぜ、析出した結晶をろ取り、真空で乾燥して、標記化合物175 mg(結晶化収率80%)を無色結晶として得た。

融点: 95-97℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.7-1.9 (1H, m), 1.9-2.1 (2H, m), 2.2-2.45 (1H, m), 2.29 (1H, d, J=4.9および10.4 Hz), 2.44 (3H, s), 2.75-3.1 (5H, m), 3.54 (1H, d, J=6.2および10.4 Hz), 3.95-4.2 (2H, m), 4.35-4.55 (1H, m), 6.91 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.15-7.6 (12H, m)。

【0119】実施例3

N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フ

エニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-ブromoプロピル [4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル190 mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し50%ジメチルアミン水溶液1mlを加え、50℃で4時間撹拌した。反応液にエーテルと水を加えて分液し、エーテル層を更に食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧濃縮した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製して、標記化合物120 mg(収率69%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.95-2.1 (2H, m), 2.28 (6H, s), 2.53 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.85-3.05 (4H, m), 4.08 (2H, t, J=6.2 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.15-7.55 (12H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン120 mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.9 mlを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物113 mg(収率85%)を無色結晶として得た。

融点: 157-159℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.3-2.5 (2H, m), 2.79 (6H, s), 2.8-3.05 (4H, m), 3.1-3.25 (2H, m), 4.11 (2H, t, J=5.5 Hz), 6.90 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.15-7.6 (12H, m)。

【0120】実施例4

N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-ブromoプロピル [4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル190 mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、イソプロピルアミン1.2 mlを加え、20時間加熱還流した。実施例3と同様に後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物120 mg(収率66%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.07

(6H, d, J=6.0 Hz), 1.95-2.1 (2H, m), 2.75-3.1 (7H, m), 4.10 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.15-7.6 (12H, m).
(b) N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン120mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.08mlを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物122mg(収率92%)を無色結晶として得た。

融点: 172-174℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.46 (6H, d, J=6.5 Hz), 2.4-2.6 (2H, m), 2.8-3.05 (4H, m), 3.16 (2H, t, J=7.8 Hz), 3.2-3.4 (1H, m), 4.09 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.1-7.55 (12H, m)。

【0121】実施例5

1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
(a) 1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール300mgをN,N-ジメチルアセトアミド15mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド260mgを加え、更に、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩20mgを加え、室温として2時間撹拌し、さらに50℃に加熱して2時間撹拌した。反応液に氷水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これを実施例1

(a)工程と同様に分液し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物20mg(収率52%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-2.5 (8H, m), 2.41 (3H, s), 2.8-3.05 (4H, m), 3.16 (1H, t, J=7.5 Hz), 4.0-4.25 (2H, m), 7.07 (1H, s), 7.1-7.4 (8H, m), 7.44 (2H, t, J=7.5 Hz), 7.58 (2H, d, J=6.9 Hz)。

(b) 1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン20mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.15mlを加えた。これに少量のヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取り、少量の混合溶媒(ヘキサノール/酢酸エチル=1/4)で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物226mg(収率93%)を無色結晶として得た。

融点: 123-125℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.85-2.2 (2H, m), 2.2-2.4 (2H, m), 2.4-2.7 (2H, m), 2.77 (3H, s), 2.7-3.05 (5H, m), 3.2-3.4 (1H, m), 3.8-4.0 (1H, m), 4.0-4.15 (1H, m), 4.2-4.4 (1H, m), 7.04 (1H, s), 7.1-7.4 (8H, m), 7.45 (2H, t, J=7.3 Hz), 7.58 (2H, d, J=7.1 Hz)。

【0122】実施例6

(2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

(a) (2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール250mgをN,N-ジメチルアセトアミド5mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド110mgを加え、次いで、(2S, 4R)-2-(2-プロモエチル)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン430mgを加え、室温で2時間撹拌し、さらに50℃で4時間撹拌した。実施例1(a)工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物510mg(収率91%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.75-0.95 (3H, m), 1.1-1.45 (10H, m), 1.45-1.75 (2H, m), 1.8-2.15 (2H, m), 2.2-2.8 (2H, m), 2.77 (3H, s), 2.8-3.1 (4H, m), 2.87 (3H, s), 3.5-3.95 (1H, m), 3.54 (1H, dd, J=4.0および12.6 Hz), 3.95-4.35 (5H, m), 5.1-5.3 (1H, m), 7.0-7.4 (9H, m), 7.43 (2H, t, J=7.5 Hz), 7.58 (2H, d, J=7.3 Hz)。

(b) (2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-

2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン
水素化アルミニウムリチウム9.4mgをテトラヒドロフラン2mlに加え、室温攪拌下に前記(a)工程で得た(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン510mgのテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液を氷冷し、硫酸ナトリウム10水和物を少しずつガスの発生がなくなるまで加え、30分攪拌して過剰の水素化物を分解した。不溶物をろ出し、ろ液を減圧濃縮して、油状物を得た。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物200mg(収率60%)の無色固体を得た。

融点: 113-115℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.65-1.85 (1H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.15-2.4 (1H, m), 2.23 (1H, dd, J=5.1および10.2Hz), 2.40 (3H, s), 2.65-2.8 (1H, m), 2.85-3.05 (4H, m), 3.49 (1H, dd, J=6.2および10.2Hz), 4.0-4.2 (2H, m), 4.35-4.5 (1H, m), 7.06 (1H, s), 7.1-7.4 (8H, m), 7.44 (2H, t, J=7.4Hz), 7.58 (2H, d, J=7.2Hz)。

【0123】実施例7

N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩
(a) N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-プロモプロピル [5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル300mgをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液1.5mlを加え、50℃で2時間攪拌した。実施例3(a)工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物170mg(収率62%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.95-2.1 (2H, m), 2.28 (6H, s), 2.53 (2H, t, J=7.3Hz), 2.8-3.05 (4H, m), 4.11 (2H, t, J=6.2Hz), 7.08 (1H, s), 7.05-7.4 (8H, m), 7.43 (2H, t, J=7.4Hz), 7.58 (2H, d, J=7.4Hz)。

(b) N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン170mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.11mlを加えた。析出した結晶をろ出し、酢酸エチルで洗浄し、真空中乾燥して、標記化合物180mg(収率96%)を無色結晶として得た。

融点: 138-140℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5 (2H, m), 2.78 (6H, s), 2.8-3.05 (4H, m), 3.1-3.25 (2H, m), 4.14 (2H, t, J=5.5Hz), 7.02 (1H, s), 7.1-7.4 (8H, m), 7.45 (2H, t, J=7.4Hz), 7.57 (2H, d, J=6.9Hz)。

【0124】実施例8

1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
(a) 1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール500mgをN, N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド412mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩412mgを加えて、室温で14時間攪拌し、さらに50℃で4時間攪拌した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物239mg(収率35%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.95 (4H, m), 1.95-2.15 (1H, m), 2.15-2.35 (2H, m), 2.35-2.55 (1H, m), 2.42 (3H, s), 2.8-3.0 (4H, m), 3.1-3.3 (1H, m), 3.9-4.15 (2H, m), 6.75-6.95 (5H, m), 7.03 (1H, t, J=7.5Hz), 7.1-7.35 (7H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン225mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.21mlを加えた。減圧濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ出し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中乾燥して、標記化合物145mg

(収率59%)を無色結晶として得た。

融点: 120-123℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.9-2.15 (2H, m), 2.15-2.4 (2H, m), 2.4-2.6 (2H, m), 2.76 (3H, s), 2.7-3.0 (5H, m), 3.15-3.4 (1H, m), 3.8-4.05 (2H, m), 4.1-4.25 (1H, m), 6.75-6.95 (5H, m), 7.05 (1H, t, J=7.6 Hz), 7.1-7.4 (7H, m)。

【0125】実施例9

N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン 3-プロモプロピル [4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル 260mg をテトラヒドロフラン 4ml に溶解し、50%ジメチルアミン水溶液 0.33ml を加えて、40℃で3時間攪拌した。さらに50%ジメチルアミン水溶液 0.33ml を追加し、40℃で5時間攪拌した。減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物 209mg (収率89%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5 (2H, m), 2.79 (6H, s), 2.87 (4H, s), 3.1-3.25 (2H, m), 4.04 (2H, t, J=5.6 Hz), 6.75-6.95 (5H, m), 7.0-7.35 (8H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン 204mg をジオキサン 4ml に溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液 0.20ml を加えた。減圧濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中乾燥して、標記化合物 143mg (収率64%)を無色結晶として得た。

融点: 139-141℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5 (2H, m), 2.80 (6H, s), 2.87 (4H, s), 3.15-3.25 (2H, m), 4.05 (2H, t, J=5.6 Hz), 6.75-6.95 (5H, m), 7.05 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.1-7.35 (7H, m)。

【0126】実施例10

2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸

塩

(a) 2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン 4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール 500mg をN, N-ジメチルアセタミド 5ml に溶解し、氷冷撪拌下にカリウムt-ブトキシド 310mg を加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩 510mg を加え、50℃で7時間攪拌した。実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物 390mg (収率55%)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.4-1.6 (2H, m), 1.6-2.0 (6H, m), 2.0-2.2 (1H, m), 2.2-2.45 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.5-2.7 (1H, m), 2.87 (4H, s), 3.25-3.4 (1H, m), 3.85-4.0 (1H, m), 3.88 (2H, t, J=6.6 Hz), 4.0-4.1 (1H, m), 6.65-6.8 (3H, m), 7.15-7.35 (5H, m)。

(b) 2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン 390mg を酢酸エチル 4ml に溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液 0.39ml を加えた。減圧で濃縮し、酢酸エチルに溶解し、静置した。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中乾燥して、標記化合物 380mg (収率89%)を無色結晶として得た。

融点: 111-112℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.4-1.6 (2H, m), 1.65-1.8 (2H, m), 1.85-2.15 (2H, m), 2.15-2.35 (2H, m), 2.35-2.6 (2H, m), 2.6-2.95 (5H, m), 2.74 (3H, s), 3.15-3.5 (1H, m), 3.8-4.0 (2H, m), 3.89 (2H, t, J=6.5 Hz), 4.1-4.2 (1H, m), 6.65-6.8 (3H, m), 7.1-7.35 (5H, m)。

【0127】実施例11

1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロ

リジン

2- [2- [4-ヒドロキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] エチル] -1-メチルピロリジン 110 mg を N, N-ジメチルアセタミド 4 ml に溶解し、氷冷撹拌下にカリウム-*t*-ブトキシド 75 mg を加え、次いで、ヨードオクタン 0.08 ml を加え、室温で 8 時間撹拌した。これを実施例 1 と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=5/1) で精製して、標記化合物 65 mg (収率 4.9%) を無色油状物として得た。

NMR スペクトル (270 MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.9 Hz), 1.2-1.5 (10H, m), 1.5-1.9 (6H, m), 1.9-2.1 (1H, m), 2.1-2.45 (3H, m), 2.37 (3H, s), 2.87 (4H, s), 3.05-3.2 (1H, m), 3.85-4.1 (2H, m), 3.87 (2H, t, J=6.6 Hz), 6.6-6.8 (3H, m), 7.1-7.35 (5H, m)。

(b) 1-メチル-2- [2- [4-オクチルオキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] エチル] ピロリジン塩酸塩

前記 (a) 工程で得た 1-メチル-2- [2- [4-オクチルオキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] エチル] ピロリジン 62 mg を酢酸エチル 3 ml に溶解し、4 規定塩化水素-酢酸エチル溶液 0.05 ml を加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これをエーテル中で粉砕し、ろ取り、エーテル 10 ml で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物 65 mg (収率 9.7%) を無色結晶とし得た。

融点: 102-104℃。

NMR スペクトル (270 MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.8 Hz), 1.2-1.55 (10H, m), 1.65-1.85 (2H, m), 1.9-2.15 (2H, m), 2.15-2.35 (2H, m), 2.35-2.6 (2H, m), 2.65-3.0 (5H, m), 2.74 (3H, s), 3.15-3.35 (1H, m), 3.75-4.0 (2H, m), 3.88 (2H, t, J=6.6 Hz), 4.05-4.2 (1H, m), 6.65-6.85 (3H, m), 7.1-7.35 (5H, m)。

【0128】実施例 12

N, N-ジメチル-3- [4-ブトキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン塩酸塩
(a) N, N-ジメチル-3- [4-ブトキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン 3-プロモプロピル [4-ブトキシ-2- (2-フェニルエチル) フェニル] エーテル 850 mg をテトラヒドロフラン 5 ml に溶解し、5.0% ジメチルアミン水溶液 2.8 ml を加え、40℃で 7 時間撹拌した。これを減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー

(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1) で精製して、標記化合物 750 mg (収率 9.7%) を無色固体として得た。

NMR スペクトル (270 MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.35-1.6 (2H, m), 1.65-1.85 (2H, m), 2.15-2.35 (2H, m), 2.64 (6H, s), 2.86 (4H, s), 2.9-3.1 (2H, m), 3.88 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.98 (2H, t, J=5.7 Hz), 6.6-6.85 (3H, m), 7.1-7.4 (5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3- [4-ブトキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン塩酸塩

前記 (a) 工程で得た N, N-ジメチル-3- [4-ブトキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン 750 mg をジオキサン 4 ml に溶解し、4 規定塩化水素-ジオキサン溶液 0.80 ml を加えた。減圧で濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物 510 mg (収率 6.2%) を無色結晶とし得た。

融点: 121-122℃。

NMR スペクトル (270 MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.35-1.6 (2H, m), 1.65-1.85 (2H, m), 2.25-2.45 (2H, m), 2.77 (6H, s), 2.86 (4H, s), 3.05-3.2 (2H, m), 3.88 (2H, t, J=6.4 Hz), 3.98 (2H, t, J=5.6 Hz), 6.4-6.8 (3H, m), 7.1-7.35 (5H, m)。

【0129】実施例 13

N, N-ジメチル-3- [4-オクチルオキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3- [4-オクチルオキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン

N, N-ジメチル-3- [4-ヒドロキシ-2- (2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン 212 mg を N, N-ジメチルアセタミド 5 ml に溶解し、氷冷撹拌下にカリウム-*t*-ブトキシド 156 mg を加え、次いで、ヨードオクタン 0.17 ml を加え、室温で 4 時間撹拌した。これを実施例 1 と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1) で精製して、標記化合物 135 mg (収率 5.2%) を無色ワックス状物として得た。

NMR スペクトル (270 MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.9 Hz), 1.2-1.45 (10H, m), 1.65-1.8 (2H, m), 1.9-

2. 1 (2H, m), 2. 27 (6H, s), 2. 51 (2H, t, J=7. 5 Hz), 2. 87 (4H, s), 3. 86 (2H, t, J=6. 6 Hz), 3. 96 (2H, t, J=6. 2 Hz), 6. 6-6. 85 (3H, m), 7. 1-7. 35 (5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン130mgをジオキサン3mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0. 15mlを加えた。減圧で濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、減圧で乾燥して、標記化合物56mg(収率40%)を無色結晶として得た。

融点: 122-124℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0. 89 (3H, t, J=6. 6 Hz), 1. 2-1. 55 (10H, m), 1. 65-1. 85 (2H, m), 2. 25-2. 45 (2H, m), 2. 76 (6H, s), 2. 86 (4H, s), 3. 05-3. 2 (2H, m), 3. 87 (2H, t, J=6. 6 Hz), 3. 98 (2H, t, J=5. 5 Hz), 6. 65-6. 8 (3H, m), 7. 1-7. 35 (5H, m)。

【0130】実施例14

N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン

3-プロモプロピル [4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル112mgをテトラヒドロフラン3mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液0. 15mlを加え、室温で2時間攪拌した。さらに50%ジメチルアミン水溶液0. 15mlを追加し、40℃で6時間攪拌した。減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=5/1)で精製して、標記化合物113mg(収率95%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 3-2. 45 (2H, m), 2. 51 (1H, t, J=2. 1 Hz), 2. 77 (6H, s), 2. 87 (4H, s), 3. 1-3. 2 (2H, m), 4. 00 (2H, t, J=5. 6 Hz), 4. 62 (2H, d, J=2. 1 Hz), 6. 7-6. 85 (3H, m), 7. 1-7. 35 (5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピル

アミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン109mgをジオキサン3mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0. 12mlを加えた。減圧で濃縮し、析出した固体を加熱溶解し、室温で冷却した。析出した結晶をろ取り、少量のジオキサンで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物81mg(収率99%)を無色結晶として得た。

融点: 165-168℃。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2. 0-2. 2 (2H, m), 2. 80 (6H, s), 2. 82 (4H, s), 3. 15-3. 3 (2H, m), 3. 52 (1H, t, J=2. 3 Hz), 3. 97 (2H, t, J=6. 0 Hz), 4. 69 (2H, d, J=2. 3 Hz), 6. 75-6. 95 (3H, m), 7. 1-7. 35 (5H, m)。

【0131】実施例15

1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン 3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトール640mgをN, N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド720mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩710mgを加え、室温で8時間攪拌した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物480mg(収率52%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 55-1. 95 (4H, m), 1. 95-2. 5 (4H, m), 2. 40 (3H, s), 2. 9-3. 2 (5H, m), 4. 05-4. 3 (2H, m), 7. 11 (1H, s), 7. 1-7. 45 (7H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 65-7. 75 (2H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン480mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0. 5mlを加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルの溶解し、静置し、析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物461mg(収率87%)を得た。

融点: 158-161℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 9-2. 2 (2H, m), 2. 2-2. 45 (2H, m),

2. 45-2. 85 (3H, m), 2. 74 (3H, s), 2. 85-3. 15 (4H, m), 3. 2-3. 4 (1H, m), 3. 8-4. 0 (1H, m), 4. 5-4. 2 (1H, m), 4. 25-4. 45 (1H, m), 7. 12 (1H, s), 7. 1-7. 5 (7H, m), 7. 59 (1H, s), 7. 65-7. 8 (2H, m)。

【0132】実施例16

1-メチル-2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン

2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトール1000mgをN,N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷機下下カリウム-ブトキシド1130mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩1110mgを加えて溶解し、室温で20時間静置した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製し、標記化合物650mg(収率45%)を油状物として得た。NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 55-1. 95 (4H, m), 1. 95-2. 55 (4H, m), 2. 44 (3H, s), 2. 9-3. 25 (5H, m), 3. 9-4. 05 (2H, m), 7. 15-7. 55 (9H, m), 7. 75-7. 9 (1H, m), 8. 06 (1H, d, J=7. 9 Hz)。

(b) 1-メチル-2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン650mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0. 68mlを加えた、減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取り、少量の混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル=1/4)で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物685mg(収率96%)を得た。

融点: 54-58℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 9-2. 9 (7H, m), 2. 87 (3H, s), 2. 9-3. 15 (4H, m), 3. 35-3. 6 (1H, m), 3. 8-4. 1 (3H, m), 7. 1-7. 4 (6H, m), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 62 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7. 8-7. 95 (2H, m)。

【0133】実施例17

1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエ

チル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン

1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトール600mgをN,N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷機下下カリウム-ブトキシド680mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩670mgを加えて溶解し、室温で64時間静置した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製し、標記化合物410mg(収率47%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 55-2. 0 (4H, m), 2. 0-2. 2 (1H, m), 2. 2-2. 4 (2H, m), 2. 4-2. 6 (1H, m), 2. 43 (3H, s), 2. 8-3. 0 (2H, m), 3. 1-3. 3 (1H, m), 3. 3-3. 45 (2H, m), 4. 0-4. 25 (2H, m), 7. 15-7. 4 (7H, m), 7. 45-7. 55 (1H, m), 7. 74 (1H, d, J=9. 0 Hz), 7. 76 (1H, d, J=7. 8 Hz), 8. 02 (1H, d, J=8. 6 Hz)。

(b) 1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン410mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0. 43mlを加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取り、少量の混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物390mg(収率86%)を得た。

融点: 102-103℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 85-2. 15 (2H, m), 2. 15-2. 4 (2H, m), 2. 4-2. 65 (2H, m), 2. 65-2. 85 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 2. 85-3. 05 (2H, m), 3. 2-3. 5 (3H, m), 3. 8-3. 95 (1H, m), 3. 95-4. 1 (1H, m), 4. 2-4. 35 (1H, m), 7. 15-7. 45 (7H, m), 7. 45-7. 6 (1H, m), 7. 77 (1H, d, J=9. 0 Hz), 7. 83 (1H, d, J=7. 7 Hz), 8. 01 (1H, d, J=8. 6 Hz)。

【0134】実施例18

N,N-ジメチル-3-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N,N-ジメチル-3-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン

参考例12で得た3-ブロモプロピル [4-メトキシ

メトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル]エーテル303mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液0.82mlを加え、40℃で5時間攪拌した。反応液を減圧で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=4/1)で精製し、標記化合物259mg(収率94%)を無色固体として得た。NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m), 2.69(6H, s), 2.87(4H, s), 3.0-3.15(2H, m), 3.47(3H, s), 4.00(2H, t, J=5.7Hz), 5.09(2H, s), 6.65-6.8(1H, m), 6.8-6.9(2H, m), 7.1-7.4(5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン255mgをジオキサン4mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液4mlを加え、室温に2.5時間静置した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=5/1)で精製し、標記化合物216mg(収率87%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.0-2.2(2H, m), 2.7-2.9(4H, m), 2.79(6H, s), 3.15-3.25(2H, m), 3.92(2H, t, J=6.0Hz), 6.5-6.65(2H, m), 6.77(1H, d, J=8.6Hz), 7.15-7.4(5H, m)。

【0135】実施例19

2-[2-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

参考例11で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール800mgをN, N-ジメチルアセトアミド15mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド765mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩855mgを加え、室温として14時間攪拌した。反応液に水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製し、標記化合物345mg(収率30%)を油脂状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.6-2.0(4H, m), 2.0-2.2(1H, m), 2.15-2.45(2H, m), 2.47(3H, s), 2.5-2.7(1H, m), 2.87(4H, s), 3.25-3.4(1H, m), 3.47(3H, s), 3.85-4.0(1H, m), 4.0-4.15(1H, m), 5.08(2H, s), 6.7-6.9(3H, m), 7.1-7.35(5H, m)。

(b) 2-[2-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン345mgをジオキサン5mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液4mlを加え、室温で2.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、真空で乾燥して、標記化合物337mg(定量的)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1.65-2.15(4H, m), 2.15-2.5(2H, m), 2.65-2.9(5H, m), 2.9-3.1(1H, m), 3.34(3H, s), 3.45-3.6(1H, m), 3.85-4.05(2H, m), 6.5-6.65(2H, m), 6.78(1H, d, J=8.6Hz), 7.15-7.35(5H, m)。

【0136】参考例1

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール
(a) 5-フェニルサリチルアルデヒド

5-プロモサリチルアルデヒド11gをエタノール/トルエン混合液(50%v/v)100mlに溶解し、フェニル硼酸10gを窒素気流中、室温で加え、攪拌した。次いで、20%水酸化パラジウム-炭素触媒1gおよび2M-炭酸ナトリウム水溶液100mlを順次加え、120℃で3時間攪拌した。触媒をろ過して不溶物を除去し、ろ液に酢酸エチルと水を加えて、分液した。酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮して固体を得た。この固体をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=7/1)で精製し、標記化合物1.2g(収率11%)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.07(1H, d, J=8.4Hz), 7.3-7.6(5H, m), 7.7-7.85(2H, m), 9.99(1H, s), 11.0(1H, s)。

(b) 4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール前記(a)工程で得た5-フェニルサリチルアルデヒド1.2gをアセニトリル20ml中、ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド2.5gと共に80℃で加熱攪拌し、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.

0] ーウンデサー 7-エン (DBU) 1 ml をアセトニトリル 5 ml に溶解して滴下し、さらに 2 時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ベンゼン/アセトニトリル = 4/1) で精製し、標記化合物 1. 52 g (収率 92%) の固体を得た。

(c) 4-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール

前記 (b) 工程で得た 4-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール 1. 5 g をエタノール 15 ml に溶解し、5%パラジウム-炭素触媒 150 mg を加え、水素気流中 50℃ で 1. 5 時間加熱攪拌した。反応液を冷却し、触媒をろ去し、減圧濃縮して溶媒を除き、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/酢酸エチル = 9/1) で精製し、標記化合物 1. 43 g (収率 94%) を無色固体として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 97 (4H, s), 6. 82 (1H, d, J = 8. 9 Hz), 7. 15-7. 6 (12H, m)。

[0137] 参考例 2

3-プロモプロピル [4-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェニル] エーテル

苛性カリ (85%) 0. 30 g を 1 ml の水に溶解し、t-ブタノール 10 ml を加え、さらに 4-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール 700 mg を加えて、50℃ で攪拌した。この溶液にジプロモプロパン 0. 82 ml を加え、80℃ で 2 時間攪拌した。反応液に氷水とベンゼンを加えて分液し、ベンゼン層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/ベンゼン = 4/1) で精製し、標記化合物 380 mg (収率 37%) を無色油脂状物として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 3-2. 5 (2H, m), 2. 85-3. 05 (4H, m), 3. 64 (2H, t, J = 6. 5 Hz), 4. 15 (2H, t, J = 5. 7 Hz), 6. 94 (1H, d, J = 8. 5 Hz), 7. 15-7. 6 (12H, m)。

[0138] 参考例 3

5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール (a) ベンジル 5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェニル エーテル 2-ベンジロキシ-4-フェニルベンズアルデヒド 4. 30 g をアセトニトリル 150 ml に溶解し、ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド 6. 00 g を加え、80℃ で加熱攪拌しながら、DBU 2. 30 ml のアセトニトリル 5 ml 溶液を滴下し、さらに 2 時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/ベンゼン = 4/1) で

精製し、標記化合物 5. 20 g (収率 96%) を油状物として得た。

(b) 5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール

前記 (a) 工程で得たベンジル 5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェニル エーテル 5. 20 g にエタノール 100 ml を加え、5%パラジウム-炭素触媒 600 mg を加えて、水素気流中 50℃ で 3 時間加熱攪拌した。冷却し、触媒をろ去し、減圧濃縮して得た固体をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/酢酸エチル = 9/1) で精製し、標記化合物 2. 39 g (収率 60%) を無色固体として得た。NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 96 (4H, s), 6. 95-7. 6 (13H, m)。

[0139] 参考例 4

3-プロモプロピル [5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェニル] エーテル

苛性カリ (85%) 0. 11 g を 1 ml の水に溶解し、t-ブタノール 10 ml を加え、さらに 5-フェニル-2- (2-フェニルエチル) フェノール 500 mg を加えて、80℃ で攪拌した。この溶液にジプロモプロパン 1. 82 ml を加え、同温度で 7 時間攪拌した。参考例 2 と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/ベンゼン = 4/1) で精製し、標記化合物 600 mg (収率 83%) を無色固体として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 3-2. 45 (2H, m), 2. 85-3. 05 (4H, m), 3. 65 (2H, t, J = 6. 5 Hz), 4. 20 (2H, t, J = 5. 7 Hz), 7. 05-7. 4 (9H, m), 7. 44 (2H, t, J = 7. 4 Hz), 7. 59 (2H, d, J = 7. 4 Hz)。

[0140] 参考例 5

2-ベンジロキシ-4-フェニル安息香酸エチル 4-フェニルサリチル酸エチル 7. 60 g を N, N-ジメチルアセタミド 100 ml に溶解し、氷冷下カリウム t-ブトキシド 3. 80 g を加え、15 分攪拌した。これに、同温で臭化ベンジル 4. 1 ml を滴下し、室温として 2 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を 2 回食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水して、減圧濃縮した。得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサノール/酢酸エチル = 9/1) で精製し、標記化合物 8. 1 g (収率 77%) を油状物として得た。NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 36 (3H, t, J = 7. 1 Hz), 4. 38 (2H, q, J = 7. 1 Hz), 5. 25 (2H, s), 7. 1-7. 6 (12H, m), 7. 91 (1H, d, J = 8. 3 Hz)。

[0141] 参考例 6

2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンジルアルコール水素化アルミニウムリチウム2.7 gをテトラヒドロフラン50 mlに加え、2-ベンジルオキシ-4-フェニル安息香酸エチル8.1 gのテトラヒドロフラン100 ml溶液を氷冷撹拌下に滴下し、後室温として30分撹拌した。再び氷冷して、硫酸ナトリウム10水和物を少しずつ加え過剰の水素化物を分解した。室温で30分撹拌し、不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮して、標記化合物4.39 g (収率61%)を無色結晶として得た。
NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 4.78 (2H, s), 5.20 (2H, s), 7.15-7.6 (13H, m)。

【0142】参考例7

2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンズアルデヒド2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンジルアルコール4.38 gを塩化メチレン70 mlに溶解し、二酸化マンガン2.6 gを加えて、室温で16時間撹拌した。不溶物をろ去し、減圧濃縮して、標記化合物4.3 g (収率98%)を無色結晶として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 5.28 (2H, s), 7.2-7.55 (10H, m), 7.58 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.93 (1H, d, J=7.9 Hz), 10.57 (1H, s)。

【0143】参考例8

4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

(a) 4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール2-ヒドロキシ-5-フェノキシベンズアルデヒド1.92 gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド3.83 gをアセトニトリル90 mlに溶解し、加熱還流下にDBU2.01 mlのアセトニトリル(10 ml)溶液を滴下し、3.5時間撹拌した。参考例3

(b) 工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1-1/1)で精製し、標記化合物2.34 g (収率91%)を油状物として得た。

(b) 4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

前記(a)工程で得た4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール2.34 gにエタノール15 mlを加え、5%パラジウム-炭素触媒250 mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=17/3)で精製し、標記化合物2.17 g (収率95%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.8-3.0 (4H, m), 6.7-6.8 (3H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.03 (1H, t, J=7.6 Hz), 7.1-7.35 (7H, m)。

【0144】参考例9

3-プロモプロピル [4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル]エーテル
苛性カリ(85%)0.136 gを水1 mlに溶解し、1-ブタノール9 mlを加え、参考例8で得た4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール500 mgとジプロモプロパン0.53 mlを参考例4と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=19/1)で精製し、標記化合物4.63 mg (収率65%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4 (2H, m), 2.88 (4H, s), 3.63 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.09 (2H, t, J=5.7 Hz), 6.75-6.95 (5H, m), 7.03 (1H, t, J=7.3 Hz), 7.1-7.35 (7H, m)。

【0145】参考例10

2-ヒドロキシ-5-メトキシメトキシベンズアルデヒド

2,5-ジヒドロキシベンズアルデヒド3.10 gとジメトキシメタン6.83 gを塩化メチレン50 mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸・1水和物0.43 gを加え、12時間加熱還流した。反応液を水及び食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、標記化合物1.03 g (収率25%)を油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 3.50 (3H, s), 5.15 (2H, s), 6.9-7.0 (1H, m), 7.2-7.3 (2H, m), 9.85 (1H, s), 10.71 (1H, s)。

【0146】参考例11

4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

(a) 4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

2-ヒドロキシ-5-メトキシメトキシベンズアルデヒド1.01 gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド2.95 gをアセトニトリル45 ml中、DBU1.24 mlを用い、参考例3(b)と同様に1時間反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=7/3)で精製し、標記化合物1.41 g (収率99%)を油状物として得た。

(b) 4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

前記(a)工程で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール1.41 gをエタノール

ル10ml中で、5%パラジウム-炭素触媒140mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、標記化合物1.32g(収率93%)を無色固体として得た。
NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.8-3.0(4H, m), 3.47(3H, s), 5.07(2H, s), 6.6-6.7(1H, m), 6.75-6.85(2H, m), 7.15-7.35(5H, m)。

【0147】参考例12

3-プロモプロピル [4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
苛性カリ(85%)0.146gを水1mlに溶解し、t-ブタノール9mlを加え、参考例8で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール4.75mgとジプロモプロパン0.56mlを参考例4と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精製し、標記化合物5.45mg(収率78%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m), 2.87(4H, s), 3.46(3H, s), 3.61(2H, t, J=6.5Hz), 4.05(2H, t, J=5.7Hz), 5.08(2H, s), 6.7-6.95(3H, m), 7.1-7.4(5H, m)。

【0148】参考例13

4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール
2-ヒドロキシ-5-ブトキシベンズアルデヒド5.20gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド12.50gをアセトニトリル50ml中、DBU4.8mlを用い、参考例3(b)工程と同様に2時間反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=6/1)で精製し、標記化合物の無色固体5.68g(収率79%)を得た。

【0149】参考例14

4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール
参考例13で得た4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール5.68gをエタノール56ml中で、5%パラジウム炭素触媒500mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=5/1)で精製し、標記化合物5.56g(収率97%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.96(3H, t, J=7.3Hz), 1.4-1.55(2H, m), 1.65-1.8(2H, m), 2.8-

3.0(4H, m), 3.86(2H, t, J=6.5Hz), 6.6-6.7(3H, m), 7.15-7.35(5H, m)。

【0150】参考例15

3-プロモプロピル [4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
苛性カリ(85%)0.18gを水1mlに溶解し、t-ブタノール9mlを加え、参考例14で得た4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール600mgとジプロモプロパン0.68mlを参考例4と同様に反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=8/1)で精製し、標記化合物8.50mg(収率98%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97(3H, t, J=7.4Hz), 1.4-1.55(2H, m), 1.65-1.8(2H, m), 2.25-2.4(2H, m), 2.87(4H, s), 3.62(2H, t, J=6.4Hz), 3.88(2H, t, J=6.4Hz), 4.04(2H, t, J=5.7Hz), 6.65-6.85(3H, m), 7.1-7.35(5H, m)。

【0151】参考例16

3-プロモプロピル [4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
参考例12で得た3-プロモプロピル [4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル238mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液4mlを加え、室温に2時間静置した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、標記化合物202mg(収率96%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m), 2.86(4H, s), 3.61(2H, t, J=6.5Hz), 4.03(2H, t, J=5.8Hz), 6.55-6.7(2H, m), 6.7-6.8(1H, m), 7.15-7.35(5H, m)。

【0152】参考例17

3-プロモプロピル [4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
参考例16で得た3-プロモプロピル [4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル109mgをアセトン4mlに溶解し、プロパルギルブロミド0.036mlおよび炭酸カリ45mgを加え、40℃で14時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/

酢酸エチル＝9/1)で精製し、標記化合物9.2 mg (収率7.6%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.25–2.4 (2H, m), 2.49 (1H, t, J=2.5 Hz), 2.88 (4H, s), 3.61 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.05 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.60 (2H, d, J=2.5 Hz), 6.75–6.85 (3H, m), 7.15–7.35 (5H, m)。

【0153】 参考例18

5-ブトキシ-2-ヒドロキシベンズアルデヒド
4-ブトキシフェノール10.0 gをエタノール13 mlに溶解し、苛性ソーダ水溶液 (19.3 g/65 ml)を加え、70℃に加熱攪拌しながらクロロホルム9.6 mlをゆっくり滴下し、同温で3時間攪拌した。冷却後、塩酸を用いてpH2とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水及び食塩水で順次洗浄し、で乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製し、標記化合物4.50 g (収率39%)を固体として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.99 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.45–1.6 (2H, m), 1.7–1.85 (2H, m), 3.95 (2H, t, J=6.5 Hz), 6.92 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.00 (1H, d, J=3.0 Hz), 7.15 (1H, dd, J=3.0及び9.0 Hz), 9.85 (1H, s), 10.64 (1H, s)。

【0154】 参考例19

(3-ベンジルオキシ-2-ナフチル) メタノール
3-ヒドロキシメチル-2-ナフトール32.5 gをN, N-ジメチルアセタミド300 mlに溶解し、氷冷攪拌下にかリウム t-ブトキシド20.9 gを徐々に加え、室温としベンジルブロミド22.2 mlをゆっくり滴下し、同温で5時間攪拌した。水200 mlおよび酢酸エチル600 mlを加えて、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水および食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製して、標記化合物24.6 gの無色固体を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.89 (2H, s), 5.24 (2H, s), 7.2–7.6 (8H, m), 7.7–7.85 (3H, m)。

【0155】 参考例20

(3-ベンジルオキシ-2-ナフチル) メチルホスホニウムクロリド

参考例19で得た (3-ベンジルオキシ-2-ナフチル) メタノール25.7 gをテトラヒドロフラン300

mlに溶解し、氷冷攪拌下に塩化チオニル7.62 mlを滴下し、室温で14時間攪拌した。反応液を減圧で濃縮し、真空で乾燥して、固体を得た。これをトルエン200 mlに溶解し、トリフェニルホスフィン25.1 gを加え、10時間加熱還流した。反応液を冷却し、固体をろ取り、トルエンで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物20.9 g (収率60%)を無色固体として得た。
NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.54 (2H, s), 5.65 (2H, d, J=14.5 Hz), 6.95 (1H, s), 7.1–7.8 (24H, m), 8.01 (1H, d, J=4.0 Hz)。

【0156】 参考例21

(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル) メタノール
水素化リチウムアルミニウム3.55 gをテトラヒドロフラン500 ml中に氷冷攪拌下に加え、2-ベンジルオキシ-1-ナフトアルデヒド24.5 gをテトラヒドロフラン100 mlに溶解して、同温で滴下し、室温で3時間攪拌した。再び冷却して、硫酸ナトリウム10水和物を徐々に加えて、過剰の水素化合物を分解し、不溶物をろ取り、ろ液を減圧濃縮した。濃縮物を少量の酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えた。析出した結晶をろ取り、混合溶媒 (ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物20.2 g (収率82%)を無色結晶として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 5.20 (2H, s), 5.26 (2H, s), 7.3–7.6 (8H, m), 7.75–7.9 (2H, m), 8.13 (1H, d, J=8.6 Hz)。

【0157】 参考例22

(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル) メチルトリフェニルホスホニウムクロリド

参考例21で得た (2-ベンジルオキシ-1-ナフチル) メタノール20.2 gをテトラヒドロフラン300 ml、塩化チオニル6.00 mlを用いて、参考例20と同様に反応し、反応液を濃縮乾燥して、2-ベンジルオキシ-1-クロロメチルナフタレンを得た。これをトルエン100 mlに溶解し、トリフェニルホスフィン25.4 gを加え、8時間加熱還流した。反応液を冷却し、固体をろ取り、トルエンで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物36.4 g (収率93%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.64 (2H, s), 5.46 (2H, d, J=13.5 Hz), 7.03 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.15–7.55 (19H, m), 7.6–7.9 (6H, m)。

【0158】 参考例23

1- (2-フェニルエチル) -2-ナフトール
(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル) メチルトリフェニルホスホニウムクロリド5.65 gとベンズアルデヒ

ド1. 0.0 gをアセトニトリル55 ml中、DBU1.7 mlを用いて、参考例1 (b)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製して、2-ベンジルオキシ-1-(2-フェニルエチニル)ナフタレン2.45 gを無色固体として得た。これをエタノール25 mlに溶解し、5%パラジウム-炭素触媒250 mgを加え、水素気流中室温で6時間攪拌した。触媒をろ去し、ろ液を濃縮乾燥し、塩化メチレン20 mlに溶解し、1M三臭化ホウ素-塩化メチレン溶液6.6 mlを氷冷下に加え、同温度で2時間静置した。反応液を減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製して、標記化合物1.56 g(収率67%)の無色固体を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.97 (2H, t, J=7.9 Hz), 3.34 (2H, t, J=7.9 Hz), 7.02 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.15-7.45 (6H, m), 7.51 (1H, t, J=8.2 Hz), 7.64 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.79 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.98 (1H, d, J=8.5 Hz)。

【0159】参考例24

3-(2-フェニルエチニル)-2-ナフトール(2-ベンジルオキシ-3-ナフチル)メチルトリフェニルホスホニウムクロリド4.28 gとベンズアルデヒド0.65 gをアセトニトリル15 ml中、DBU1.3 mlを用いて、参考例1 (b)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製して、2-ベンジルオキシ-3-(2-フェニルエチニル)ナフタレン2.04 gを無色固体として得た。これをエタノール20 mlとテトラヒドロフラン8 mlの混合液に溶解し、5%パラジウム-炭素触媒200 mgを加え水素気流中、室温で3時間攪拌した。触媒をろ去し、ろ液を濃縮乾燥し、塩化メチレン36 mlに溶解し、1M三臭化ホウ素-塩化メチレン溶液5.4 mlを氷冷下に加えて、室温で1時間静置した。反応液を減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製して、標記化合物1.17 g(収率66%)の無色固体を得た。NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.95-3.15 (4H, m), 7.15-7.45 (8H, m), 7.56 (1H, s), 7.64 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz)。

【0160】参考例25

(2S, 4R)-4-ヒドロキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリンエチル
L-プロリンエチルエステル塩酸塩20 gを塩化メチレ

ン300 ml中、トリエチルアミン31 mlと共に氷冷下に攪拌し、クロル炭酸オクチル22 mlを滴下し、室温で2時間攪拌した。減圧濃縮し、酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧で濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製して、油状の標記化合物29.4 g(収率90%)を得た。NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, J=6.6 Hz), 1.15-1.45 (13H, m), 1.45-1.7 (2H, m), 1.7-1.9 (1H, m), 2.05-2.15 (1H, m), 2.2-2.4 (1H, m), 3.45-3.75 (2H, m), 3.95-4.3 (4H, m), 4.4-4.6 (1H, m)。

【0161】参考例26

(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル
氷冷攪拌下にトリホスゲン21.1 gをピリジン300 ml中に徐々に加え、室温として30分攪拌した。これに参考例25で得た(2S, 4R)-4-ヒドロキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル22.5 gをピリジン200 mlに溶解して滴下し、さらに30分攪拌し、ジメチルアミン14.5 gを加えて、室温とし20分攪拌した。反応液を氷水中に注加し、酢酸エチルで抽出した。抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製して、油状の標記化合物27.2 g(収率98%)を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, J=6.7 Hz), 1.15-1.45 (13H, m), 1.5-1.75 (2H, m), 2.2-2.3 (1H, m), 2.35-2.55 (1H, m), 2.87 (3H, s), 2.91 (3H, s), 3.6-3.85 (2H, m), 3.95-4.3 (4H, m), 4.35-4.5 (1H, m), 5.2-5.3 (1H, m)。

【0162】参考例27

(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-(p-トルエンシルボニルオキシメチル)ピロリジン
(a) (2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ヒドロキシメチル-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン
水素化ほう素リチウム4.70 gをテトラヒドロフラン100 mlに氷冷攪拌下に加え、次いで参考例26で得た(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル28.3 gをテトラヒドロフラン300 mlに溶解して滴下

し、室温として2時間攪拌した。再び冷却し、希塩酸を加えて、過剰の水素化物を分解した。酢酸エチルを加えて目的物を抽出し、抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=1/5）で精製して、油状の標記化合物23.6g（収率9.3%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=6.7 Hz), 1.15-1.45 (10H, m), 1.5-1.7 (2H, m), 1.7-1.85 (1H, m), 2.15-2.3 (1H, m), 2.87 (3H, s), 2.91 (3H, s), 3.55-3.9 (3H, m), 3.57 (1H, d, J=4.1および12.8 Hz), 4.05-4.2 (1H, m), 4.10 (2H, t, J=6.6 Hz), 5.1-5.2 (1H, m)。

【0163】(b) (2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-(p-トルエンスルホンオキシメチル)ピロリジン
前記(a)工程で得た(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-ヒドロキシメチルピロリジン23.6gを塩化メチレン300mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸無水物4.4.7gを加えて溶解し、氷冷し、攪拌下、トリエチルアミン19mlを滴下し、室温として1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルと水を加えて分液した。酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=3/2）で精製して、油状の標記化合物32.5g（収率9.5%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.15-1.4 (10H, m), 1.45-1.7 (2H, m), 2.1-2.3 (2H, m), 2.45 (3H, s), 2.83 (3H, s), 2.89 (3H, s), 3.35-3.85 (5H, m), 3.85-4.4 (5H, m), 5.1-5.2 (1H, m), 7.34 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.77 (2H, d, J=8.3 Hz)。

【0164】参考例28

(2R, 4R)-2-シアノメチル-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例27で得た(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-(p-トルエンスルホンオキシメチル)ピロリジン32.5gをジメチルホルムアミド350mlに溶解し、80℃に加熱攪拌しながら青酸ソーダ0.80gを15分間隔で4回にわたって計3.20gを加え、同温で1.

5時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=1/1）で精製して、油状の標記化合物22.1g（収率9.5%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=6.7 Hz), 1.15-1.45 (10H, m), 1.5-1.75 (2H, m), 2.05-2.25 (1H, m), 2.35-2.55 (1H, m), 2.7-2.9 (1H, m), 2.85 (3H, s), 2.91 (3H, s), 3.05-3.3 (1H, m), 3.55-3.95 (2H, m), 4.0-4.25 (1H, m), 4.09 (2H, t, J=6.6 Hz), 5.15-5.3 (1H, m)。

【0165】参考例29

(2S, 4R)-2-(4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-ピロリジン)酢酸エチル

参考例28で得た(2R, 4R)-2-シアノメチル-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン22.1gをエタノール100mlに溶解し、塩化水素を導入して飽和し、さらに塩化水素を通じながら3.5時間加熱還流した。減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=2/1）で精製して、油状の標記化合物18.8g（収率7.5%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, J=6.6 Hz), 1.2-1.45 (10H, m), 1.25 (3H, t, J=7.1 Hz), 1.5-1.75 (2H, m), 1.9-2.15 (1H, m), 2.3-2.5 (2H, m), 2.85 (3H, s), 2.90 (3H, s), 2.9-3.2 (1H, m), 3.54 (1H, dd, J=3.9及び2.7 Hz), 3.55-3.9 (1H, m), 4.0-4.2 (2H, m), 4.13 (2H, q, J=7.1 Hz), 4.2-4.35 (1H, m), 5.1-5.25 (1H, m)。

【0166】参考例30

(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-2-(2-ヒドロキシエチル)-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例29で得た(2S, 4R)-2-(4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-ピロリジン)酢酸エチル17.2g、水素化ほう素リチウム5.60g及びテトラヒドロフラン100mlを用い、参考例27(a)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン/酢酸エチル=1/1）で精製して、油状の標記化合物11.4g（収率7.4%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 8 8 (3H, t, $J=6.6$ Hz), 1. 2-1. 45 (1 OH, m), 1. 45-2. 05 (5H, m), 2. 2-2. 35 (1H, m), 2. 85 (3H, s), 2. 91 (3H, s), 3. 27 (1H, d, $J=5.1$ および 12. 4 Hz), 3. 55-3. 8 (3H, m), 4. 09 (2H, t, $J=6.7$ Hz), 4. 2-4. 4 (1H, m), 5. 15-5. 25 (1H, m)。

【0167】参考例31

(2S, 4R)-2-(2-プロモエチル)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例30で得た(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-2-(2-ヒドロキシエチル)-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン1. 00gをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、トリフェニルホスフィン1. 00gを加えて溶解し、氷冷条件下、四臭化炭素1. 30gを加えて溶解し、室温として1時間撹拌した。反応液に酢酸エチルと5%重曹水を加えて分液し、酢酸エチル層を順次5%重曹水と食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサンの酢酸エチル=1/1)で精製して、油状の標記化合物1. 02g(収率86%)を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0. 8 8 (3H, t, $J=6.6$ Hz), 1. 15-1. 5 (1 OH, m), 1. 5-1. 75 (2H, m), 1. 8-

2. 1 (2H, m), 2. 2-2. 55 (2H, m), 2. 85 (3H, s), 2. 91 (3H, s), 3. 2-5. 3. 6 (2H, m), 3. 50 (1H, d, $J=4.6$ および 12. 6 Hz), 3. 6-3. 95 (1H, m), 4. 0-4. 2 (3H, m), 5. 1-5. 25 (1H, m)。

【0168】試験例1

血管収縮実験

平滑筋収縮反応は、Van Neutenら (J. Pharmacol. Exp. Ther., 218, 217-230, 1981) の方法によって行った。体重約500gのSD系雄性ラットを放血致死後、尾動脈を摘出した。動脈は付帯組織を除去したのち、(2×20mm)のラセン標本を作製した。この標本を、Tyrode液10mlを含む37℃に保温したマグナス管内に懸垂し、混合ガス(95% O_2 , 5% CO_2)を通気して1時間放置した後、実験に用いた。初期張力として0.5gを負荷し、張力をトランスジューサーを用いて等尺性に記録した。血管収縮薬として、セロトニン 3×10^{-6} Mをマグナス管内に添加し、収縮反応が安定した後に各被検液を累積的に添加し、最後にババペリン 10^{-6} Mを添加した。被検薬添加前に張力を100%とし、ババペリン添加5分後の張力を0%とした。張力を50%まで低下するに要する被検薬の濃度を IC_{50} 値とし、最小二乗法回帰直線により算出した。その結果を表2に示す。

【0169】

【表2】

化合物	IC_{50} μM
実施例1の化合物	0.23
実施例3の化合物	0.19
実施例10の化合物	0.11
実施例15の化合物	0.27

【0170】試験例2

スクアレンシンターゼ阻害活性

スクアレンシンターゼ阻害活性は、文献記載の方法[米国特許第5,102,907号, Anal. Biochem. 203, 310 (1992) 等]によって測定した。すなわち、嫌気条件下、16×110mmのスビッツ管で反応を行った。反応液組成を以下に示す。反応液1アッセイ100 μl 中に、50mM $\text{KH}_2\text{PO}_4/\text{K}_2\text{HPO}_4$ (pH 7.5:リン酸二水素カリウム-リン酸水素ナトリウム緩衝液、10mM NaF (フッ化ナトリウム)、10mM MgCl_2 (塩化マグネシウム)、2mM DTT (ジチオスレイトール)、50mMアスコルビン酸、20単位/ml アスコルビン酸オキシダーゼ、1mM NADPH (ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドリドリン酸)、10 μM [4-¹⁴C]-FPP(ファルネシルピロリン酸; 58 $\mu\text{Ci}/\mu\text{mol}$

1)、60 $\mu\text{g}/\text{ml}$ ラット肝ミクロソーム懸濁液及び阻害剤溶液(試験化合物のメタノールまたは水溶液 5 μl)を含む。ラット肝ミクロソーム懸濁液を最後に添加して反応を開始した。反応は37℃の恒温槽で行い、20分間のインキュベート後、100 μl の40%KOH(含水酸化カリウム)と95% EtOH(含水エタノール)の1:1混合液を添加して、反応を停止した。これをさらに65℃で、30分間加熱した後に冷却し、2mlのヘキサンを加えてスクアレンを抽出した。ヘキサンのうち1mlを採り、10mlのシンチレーターと混合して、液体シンチレーションカウンタで放射能を測定した。試験化合物の阻害活性は、該酵素反応液中において、該試験化合物を含む被検体を、酵素標品及び基質とコ-インキュベートさせることにより、該酵素活性に対する阻害活性を測定した。好

ましい試験化合物の50% 阻害濃度(IC₅₀)を表3に示す。

【表3】

【0171】

化合物	IC ₅₀ μ M
実施例1の化合物	0.20
実施例3の化合物	0.12
実施例10の化合物	0.51
実施例15の化合物	0.48

【0172】

製剤例1

カプセル剤

実施例10の化合物

20.0 mg

乳糖

158.7

トウモロコシデンプン

70.0

ステアリン酸マグネシウム

1.3

250 mg

上記処方剤の粉末を混合し、60メッシュのふるいを通して後、この粉末を250mgの3号ゼラチンカプセルに

入れ、カプセル剤とする。

【0173】

製剤例2

錠剤

製造例10の化合物

20.0 mg

乳糖

154.0

トウモロコシデンプン

25.0

ステアリン酸マグネシウム

1.0

200 mg

上記処方剤の粉末を混合し、打錠機により打錠して、1錠200mgの錠剤とする。

【0174】この錠剤は必要に応じて糖衣を施すことができる。

【0175】

【発明の効果】化合物(1)は、セロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であり、毒性が弱いので、(1)血管内皮細胞や血小板に分布するセロトニン2受容体を遮断し、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤も

しくは予防剤(好適には、治療剤)またはこれらの疾患に起因する各種疾病、例えば、冠動脈疾患、脳血管障害等の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)として有用であり、(2)コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤または予防剤として有用であり、(3)更にセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤または予防剤(好適には、治療剤)として有用である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.⁶

識別記号

F I

A 6 1 K 31/40

A E N

A 6 1 K 31/40

A E N

C 0 7 D 207/08

C 0 7 D 207/08

207/12

207/12

211/22

211/22

(72)発明者 谷本 達夫

東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

PHENOXYALKYLAMINES

Patent number: JP10316634
Publication date: 1998-12-02
Inventor: FUJIMOTO KOICHI; TANAKA NAOIKI;
OGAWA TAKETOSHI; TANIMOTO
TATSUO
Applicant: SANKYO CO
Classification:
- **International:** **C07D211/22; A61K31/135; A61K31/40;**
A61P7/00; A61P7/02; A61P9/10;
A61P43/00; C07C217/18; C07D207/08;
C07D207/12; C07D207/08; C07D211/00;
A61K31/135; A61K31/40; A61P7/00;
A61P9/00; A61P43/00; C07C217/00;
C07D207/00; (IPC1-7): C07C217/18;
A61K31/135; A61K31/40; C07D207/08;
C07D207/12; C07D211/22
- **European:**
Application number: JP19970125202 19970515
Priority number(s): JP19970125202 19970515

[Report a data error here](#)

Abstract of JP10316634

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new compound useful as a therapeutic agent or a preventing agent for thrombotic diseases, hyperlipemia, arteriosclerotic diseases, etc. **SOLUTION:** The compound is represented by formula I [R<1> is a di-1-6C alkylamino, a (substituted)3-6-membered saturated heterocycle, etc.; R<2> a to R<2> c are each H, a (substituted)aryl, etc.; R<3> a to R<3> d are each H, a 1-6C alkoxy, etc.; A is a single bond or a 1-6C alkylene], e.g. 1-methyl-2-[2-[4-phenyl-2-(2-phenylmethyl)phenoxy]-ethyl]pyrrolidine. The compound of formula I is obtained by reacting a compound of formula II (R<4> a to R<4> c are each R<2> a to R<2> c whose hydroxy group is protected), e.g. 4-phenyl-2-(2-phenylthyl)phenol with a compound of formula III (R<1> a is a protected di-1-6C alkylamino, etc.; Z is a halogen, etc.), e.g. 2-(2-chloroethyl)-1-methylpyrrolidine hydrochloride in an inert solvent in the presence of a base, preferably at 10-80 deg.C for 1-24 hr and carrying out removal, etc., of a protecting group.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide